

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2002 年 10 月 3 日 (03.10.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/076918 A1(51) 国際特許分類⁷: C07C 65/24, 65/40, 69/157, 69/94,
235/64, 255/24, 255/63, 317/40, C07D 295/18, 215/08,
233/02, 213/30, 213/75, 211/16, 231/12, 239/47

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてののみ): 鈴木 賢治
(SUZUKI, Kenji) [JP/JP]; 〒538-0042 大阪府 大阪市鶴
見区 今津中 2 丁目 5-2-3 0 5 Osaka (JP). 布川 陽
一 (NUNOKAWA, Youichi) [JP/JP]; 〒560-0045 大阪府
豊中市 刀根山 3 丁目 6-1-4 0 3 Osaka (JP). 小郷
尚久 (OGOU, Naohisa) [JP/JP]; 〒567-0887 大阪府 茨
木市 西中条町 4-5-3 0 8 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/03017

(22) 国際出願日: 2002 年 3 月 27 日 (27.03.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(74) 代理人: 石田 敬, 外 (ISHIDA, Takashi et al.); 〒105-
8423 東京都港区虎ノ門三丁目 5 番 1 号 虎ノ門 3 7 森
ビル 青和特許法律事務所 Tokyo (JP).

(26) 国際公開の言語: 日本語

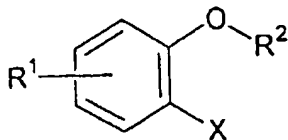
(30) 優先権データ:
特願 2001-91003 2001 年 3 月 27 日 (27.03.2001) JP

(81) 指定国 (国内): BR, CA, CN, HU, JP, KR, US.

(84) 指定国 (広域): ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE,
DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR).(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): サン
トリー株式会社 (SUNTORY LIMITED) [JP/JP]; 〒
530-8203 大阪府 大阪市北区堂島浜 2 丁目 1 番 4 0 号
Osaka (JP). 株式会社サントリー生物医学研究所
(SUNTORY BIOMEDICAL RESEARCH LIMITED)
[JP/JP]; 〒618-8503 大阪府 三島郡島本町 若山台 1 丁
目 1 番 1 号 Osaka (JP).

添付公開書類:

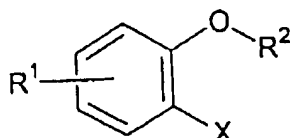
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。(54) Title: NF- κ B INHIBITOR CONTAINING SUBSTITUTED BENZOIC ACID DERIVATIVE AS ACTIVE INGREDIENT(54) 発明の名称: 置換安息香酸誘導体を有効成分とする NF- κ B 阻害剤

(I)

(57) Abstract: A novel NF- κ B inhibitor represented by the fol-
lowing formula. (I)

(57) 要約:

下記式により表わされる、新規な NF- κ B 阻害剤の提供。

(I)

明 細 書

置換安息香酸誘導体を有効成分とするNF- κ B阻害剤

発明の分野

本発明は、新規な置換安息香酸誘導体に関し、さらに詳細には置換安息香酸誘導体もしくはそのヒドロキノン体またはその薬理学的に許容し得る塩を有効成分とするNF- κ B阻害剤であり、NF- κ Bの活性化に起因する疾患の予防または治療薬に関する。

背景技術

NF- κ Bは、遺伝子発現の調節を行う蛋白質であって、いわゆる転写調節因子の一つである。正常細胞をインターロイキン-1 (IL-1) やTNF- α といった炎症性サイトカイン、リポ多糖または紫外線などで刺激すると、NF- κ Bは活性化されて細胞質から核内へ移行し、ゲノムDNA上の特異塩基配列に結合して種々の遺伝子の発現に関与するようになる (Blackwell, T.S. and Christman, J.W. (1997) Am. J. Respir. Cell. Mol. Biol., 17, 3-9)。

NF- κ Bによって発現調節を受けている遺伝子は、IL-1、IL-6、IL-8、TNF- α などの炎症性サイトカインや、ICAM-1、VCAM-1、ELAM-1などの細胞接着分子、および誘導型NO合成酵素 (iNOS) などの免疫炎症反応に関与するものに多く認められている (Collins, T., Read, M.A., Neish, A.S., Whitley, M.Z., Thanos, D. and Maniatis, T. (1995) Faseb. J., 9, 899-909)。さらに炎症性サイトカインは、受容体に結合すると種々の経路によってNF- κ Bを活性化するシグナルを伝達していくことが知られており、このことが炎症を一層悪化させる原因とも考えられている。このように、炎症にお

いてNF- κ Bの活性化は、疾病の原因および増悪因子として理解されている (Baeuerle, P.A. and Baichwal, V.R. (1997) Adv. Immunol. 65, 111-137)。

また、HIV、HTLV-1、CMV、アデノウイルスなどは宿主細胞におけるNF- κ Bを活性化することが近年報告されており (Dezube, B.J., Pardee, A.B., Beckett, L.A., Ahlers, C.M., Ecto, L., Allen-Ryan, J., Anisowicz, Z.A., Sager, R. and Crumpacker, C.S. (1992) J. Acquir. Immune Defic. Syndr., 5, 1099-1104 ; Nabel, G. and Baltimore, D. (1987) Nature 326, 711-713 ; Fazely, F., Dezube, B.J., Allen-Ryan, J., Pardee, A.B. and Ruprecht, R.M. (1991) Blood, 77, 1653-1656 ; Munoz, E. and Israel, A. (1995) Immunobiology, 193, 128-136)、NF- κ Bの活性化が感染宿主細胞におけるウイルスの自己複製、増殖に関与すると考えられている。

従って、NF- κ Bの活性化を抑制することにより、これらの炎症性サイトカイン、細胞接着分子遺伝子およびウイルスの発現誘導を一網打尽に抑制することが可能であり、NF- κ B活性化抑制物質は、NF- κ Bの活性化が直接または間接的に原因となる疾患、特に種々の炎症性疾患、自己免疫性疾患の治療薬、免疫抑制剤、ウイルス性疾患の治療薬として有望である。

現在、多くの抗炎症剤が変形性関節症、腰痛症、慢性関節リウマチ等の治療を目的として臨床的に使用されているが、種々の炎症性サイトカインの産生や細胞接着分子の発現を抑制するものとしては、いまだに有効なものは出現していない。繁用されるNSAID (非ステロイド抗炎症剤) は、アラキドン酸代謝経路においてシクロオキシゲナーゼを阻害することにより、プロスタグランジンの産生を抑制するが、一般には直接サイトカインの産生は阻害しない。ステロ

イド類は、複数のサイトカインの産生を抑制するが、望ましくないホルモン作用や感染症の増悪、消化性潰瘍の発生、中枢作用などの重篤な副作用が現れることが知られており、長期投与ができないという問題がある。

しかし、近年これらの抗炎症剤の中で高用量でNF- κ Bの活性化を抑制する薬剤が幾つか報告されるようになった (Auphan, N., DiDonato, J.A., Rosette, C., Helmberg, A. and Karin, M. (1995) *Science* 270, 286-290.; Shackelford, R.E., Alford, P.B., Xue, Y., Thai, S.F., Adams, D.O. and Pizzo, S. (1997) *Mol. Pharmacol.*, 52, 421-429.; Bitko, V., Velazquez, A., Yang, L., Yang, Y.C. and Barik, S. (1997) *Virology*, 232, 369-378)。例えばサリチル酸やアスピリンなどの安息香酸誘導体がNF- κ Bの活性化を抑制することが報告されているが (*Science*, 265, 956-959, 1994)、効力が不十分であることや、多岐にわたる薬理作用に起因する副作用の発現などが問題点として指摘されている。

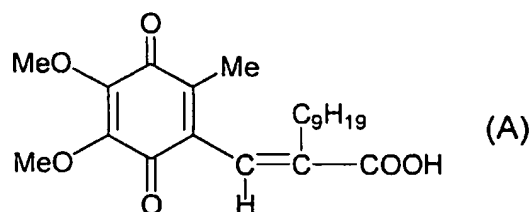
従って、より特異的にNF- κ Bの活性化を阻害する安全性の高い薬剤の開発が望まれており、多くの研究者によりNF- κ B活性化阻害物質の探索や分子設計がおこなわれている。

近年、NF- κ Bの活性化阻害物質として、イソカルバゾール誘導体 (特開平8-319238号公報、特開2000-169479号公報)、イソキノリン誘導体 (特開平10-87491号公報、特開平11-180873号公報)、ベンゾキノン誘導体 (特開平7-291859号公報、特開平11-266872号公報)、 β -ラクタム誘導体 (特開平11-71278号公報)、リグナン誘導体 (特開平10-175861号公報)、ベンジリデン誘導体 (PCT/JP98/04774)、ピリミジン-5-カルボキサミド誘導体 (W097/09315号公報、W097/09325号公報)、シクロペンタベンゾフラン誘導体 (W000/08007号公報)、ベンゼン誘導体 (W000/15603号公報)、ピロリジンジチ

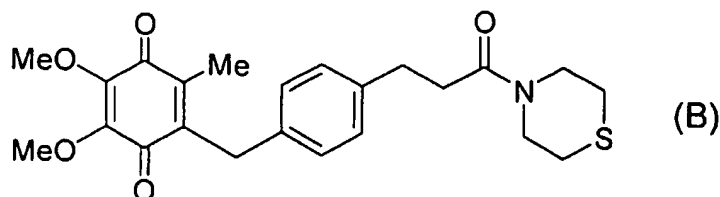
オカーボネート(PDTC) (Eur. J. Immunol. (1999) 29, 1890-1900)、3-デアザアデノシン(DZA) (J. Biol. Chem. (1999) 274, 27, 18981-18988)、2,2'-ビ-1H-ピロール誘導体 (J. Immunol. (1999) 162, 7102-7109) などが報告されている。

これらの物質がNF- κ Bの活性化を抑制する作用機序に関しては不明なものが多いが、抗酸化作用や蛋白質のリン酸化抑制作用によると考えられる物質に関しては、物質としての安定性や作用の特異性が問題になると考えられる。また、現時点においては転写因子NF- κ Bの活性化阻害剤として十分に効果をもつ薬剤は得られていない。

一方、特開平7-291859号公報において下記ベンゾキノン誘導体 (A) が、NF- κ Bの活性化阻害物質として開示されている。



また、特開平11-266872号公報において、NF- κ Bの活性化を抑制する物質の新規なスクリーニング法が開示されており、その方法により見出せるNF- κ Bの活性化を抑制する物質として下記ベンゾキノン誘導体 (B) が挙げられている。



しかしながら、NF- κ B阻害物質として十分な効力を有する化合物であるとは言えず、よりNF- κ B阻害活性の強い物質の探索が望まれ

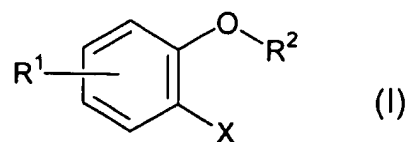
ていた。

発明の開示

本発明は、NF- κ Bの活性化を抑制することによって、NF- κ Bの活性化に起因する疾患、例えば種々の炎症メディエーターの過剰産生やウイルスの増殖に起因する疾病に対する予防および治療薬を提供するものである。より具体的にはNOやTNF- α の過剰産生が発症原因と考えられる疾患、例えば敗血症ショック、変形性関節症、慢性関節リウマチ、悪液質、多臓器不全、炎症性腸疾患、マラリア、後天性免疫不全症候群、ヒトT細胞白血病、髄膜炎、肝炎、心筋炎、II型糖尿病、多発性硬化症、ベーチェット病、全身性エリテマトーデス、虚血性心疾患などの治療および予防薬を提供するものである。

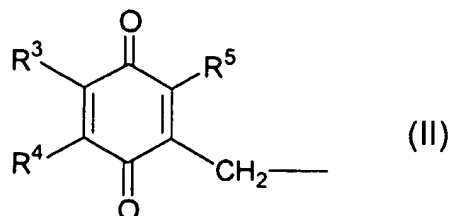
本発明者らはNF- κ Bの活性化を抑制する物質について鋭意研究を重ねた結果、一般式（I）で表される新規置換安息香酸誘導体もしくはそのヒドロキノン体またはその薬理学的に許容し得る塩が強力にNF- κ Bが活性化するのを抑制することを見出し、本発明を完成するに至った。

すなわち、本発明は、次の一般式（I）

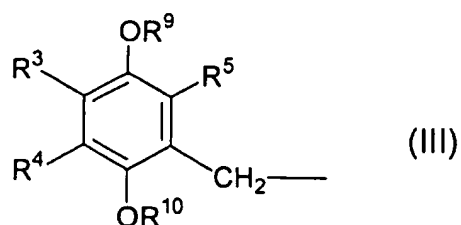


（式中、

R¹は、下記の一般式（II）



または下記の一般式 (III)



(式中、 R^3 、 R^4 および R^5 は各々独立に水素原子、炭素数1～6のアルキル基または炭素数1～6のアルコキシ基であり、 R^9 および R^{10} は各々独立に水素原子、炭素数1～6のアルキル基または炭素数2～11のアシル基を示す) であり；

R^2 は、水素原子、置換されていてもよい炭素数1～6の低級アルキル基、置換されていてもよい炭素数6～12のアリール基、置換されていてもよい炭素数4～11のヘテロアリール基、置換されていてもよい炭素数7～14のアラルキル基、置換されていてもよい炭素数5～13のヘテロアリールアルキル基を示すか、あるいは炭素数2～11のアシル基であり；

Xは、エステル化またはアミド化されていてもよいカルボキシ基を示す)

で表される新規置換安息香酸誘導体、該新規置換安息香酸誘導体もしくはそのヒドロキノン体またはその薬理学的に許容し得る塩を有効成分とするNF- κ B阻害剤、およびこれらの炎症性疾患、自己免疫性疾患、ウイルス性疾患の予防または治療薬への使用に関し、これ

らはIL-1、TNF- α 、IL-2、IL-6、IL-8、iNOS、顆粒球コロニー刺激因子、インターフェロン- γ 、ICAM-1、VCAM-1、ELAM-1、主要組織適合抗原系クラスI、主要組織適合抗原系クラスII、 β -2マイクログロブリン、免疫グロブリン軽鎖、血清アミロイドA、アンジオテンシノーゲン、補体B、補体C4、c-myc、HIV、HTLV-1、SV-40、CMVおよびアデノウイルスからなる群より選ばれた1または2以上の物質の遺伝子の発現抑制剤として使用される。

また、一般式(I)で表される新規置換安息香酸誘導体もしくはそのヒドロキノン体またはその薬理学的に許容し得る塩を有効成分とする、NF- κ Bの活性化に起因する疾患の予防または治療薬が提供される。

図面の簡単な説明

図1は、7週齢C3H/HeN系雌性マウスにGalN/LPSを腹腔内投与し、その直後に実施例112の化合物を腹腔内投与し、刺激60分後に肝臓を摘出し、肝臓中のTNF- α mRNA量(図中)、IL-1 β mRNA量(図右)を、また90分後に心臓採血を行い、血漿中TNF- α 量(図左)を測定した結果を示す。

図2は、7週齢C3H/HeN系雌性マウスにGalN/LPSを腹腔内投与し、その10分前に実施例112の化合物を経口投与し、刺激して60分後に肝臓を摘出し、肝臓中のTNF- α mRNA量(図右)を、また90分後に心臓採血を行い、血漿中TNF- α 量(図左)を測定した結果を示す。

図3は、7週齢C3H/HeN系雌性マウスにGalN/LPSを腹腔内投与し、その10分前に実施例157の化合物を経口投与し、刺激して60分後に肝臓を摘出し、肝臓中のTNF- α mRNA量(図右)を、また90分後に心臓採血を行い、血漿中TNF- α 量(図左)を測定した結果を示す。

図4は、ラット右後肢足蹠にカラゲニンを皮内投与し、その直後

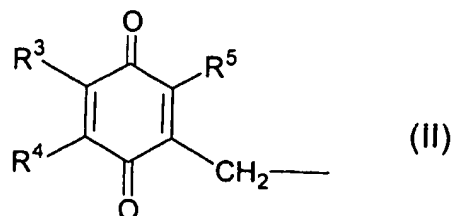
に実施例112の化合物または実施例157の化合物を 100 mg/kg で経口投与し、陽性対照としてインドメタシンは、10 mg/kg で経口投与した場合の足浮腫率を示す。（カラゲニン投与後の足容積-投与前の足容積）/投与前の足容積 \times 100 で算出し、平均足浮腫率 \pm SEで示した。

発明の実施の形態

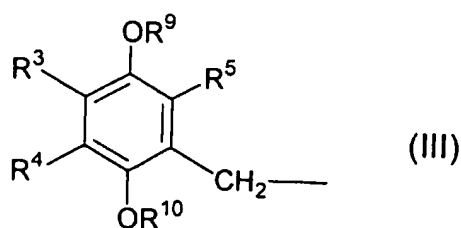
本発明の有効成分である置換安息香酸誘導体が分子内にベンゾキノン環を有している場合、容易に還元して対応するヒドロキノン体を得ることができる。従って、本発明においては、本発明の有効成分である置換安息香酸誘導体のベンゾキノン環が還元されたヒドロキノン体も、本発明の有効成分として使用できる。ヒドロキノン体とは、本発明に係るベンゾキノン誘導体が触媒などによって化学的にまたは酵素などによって生化学的にベンゾキノン環の1位および/または4位のオキソが還元されてヒドロキシ基に変換されるか、または、生体内で還元されて、かつ、ベンゾキノン誘導体と同等の活性を有するものを意味する。

また、本発明において薬理学的に許容し得る塩としては、例えば塩酸、硝酸、硫酸、リン酸、臭化水素酸などの無機酸またはマレイン酸、フマル酸、酒石酸、乳酸、クエン酸、酢酸、メタンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸、アジピン酸、パルミチン酸、タンニン酸などの有機酸、リチウム、ナトリウム、カリウムなどのアルカリ金属、カルシウム、マグネシウムなどのアルカリ土類金属のような無機金属、リジンなどの塩基性アミノ酸との塩を挙げることができる。

式中、 R^1 は、下記の一般式（II）：



または下記的一般式 (III) :



を示す。

また、式中、 R^3 、 R^4 および R^5 は各々独立に水素原子、炭素数1～6のアルキル基または炭素数1～6のアルコキシ基を示し、アルキル基の好ましい例としてはメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、*sec*-ブチル、*tert*-ブチル、ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、*tert*-ペンチル、*n*-ヘキシルなどの炭素数1～6の直鎖または分岐鎖の飽和脂肪族炭化水素基、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどの飽和脂環式炭化水素基およびシクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロブチルメチルなどの飽和脂環式炭化水素基—脂肪族炭化水素基などが挙げられる。また、アルコキシ基とは、前記のアルキル基が酸素原子に結合した基をいい、アルコキシ基の好ましい例としてはメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、*n*-ブトキシ、イソブトキシ、*sec*-ブトキシ、*tert*-ブトキシなどの炭素数1～6の直鎖または分岐鎖アルコキシ基が挙げられる。

また、 R^9 および R^{10} は各々独立に水素原子、炭素数1～6のアル

キル基または炭素数 2 ～ 11 のアシル基を示し、アルキル基の好ましい例としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペンチル、n-ヘキシルなどの炭素数 1 ～ 6 の直鎖または分岐鎖の飽和脂肪族炭化水素基、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどの飽和脂環式炭化水素基およびシクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロブチルメチルなどの飽和脂環式炭化水素基—脂肪族炭化水素基などが挙げられる。また、アシル基の好ましい例としては、アセチル、プロパノイル、ブタノイル、シクロプロピルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル、ベンゾイル、2-ピリジンカルボニル、3-ピリジンカルボニル、4-ピリジンカルボニルなどの基が挙げられる。

また、 R^2 は、水素原子、置換されていてもよい炭素数 1 ～ 6 の低級アルキル基、置換されていてもよい炭素数 6 ～ 12 のアリール基、置換されていてもよい炭素数 4 ～ 11 のヘテロアリール基、置換されていてもよい炭素数 7 ～ 14 のアラルキル基、置換されていてもよい炭素数 5 ～ 13 のヘテロアリールアルキル基を示すか、あるいは炭素数 2 ～ 11 のアシル基を示す。

本発明において「置換されていてもよい」で表される置換基の具体例としては、例えばアリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ、アルコキシ、アシルオキシ、カルボキシル、アルコキシカルボニル、アリールオキシカルボニル、置換されていてもよいカルバモイル、置換されていてもよいアミノおよびシアノなどの置換基およびハロゲン原子などが挙げられる。

従って、アルキル基の好ましい例としては前記したものが挙げられ、置換された炭素数 1 ～ 6 の低級アルキル基の好ましい例として

は、ヒドロキシメチル、アルコキシメチル、アミノメチル、モノまたはジ置換されたアミノメチル（例えば、N-メチルアミノメチル、N,N-ジメチルアミノメチル）、シアノメチル、カルボキシメチル、メトキシカルボニルメチル、エトキシカルボニルメチル、カルバモイルメチルなどの基が挙げられる。

置換されていてもよい炭素数6～12のアリール基の好ましい例としては、フェニル、4-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、2-メトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、4-モルフォリノフェニル、4-シアノフェニル、4-クロルフェニル、4-ニトロフェニル、1-ナフチルなどの基が挙げられる。

置換されていてもよい炭素数4～11のヘテロアリール基の好ましい例としては、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、2-フラニル、2-チエニル、2-ピリミジニル、2-キノリル、3-イソキノリルなどの基が挙げられる。

置換されていてもよい炭素数7～14のアラルキル基の好ましい例としては、ベンジル、4-ニトロベンジル、3-ニトロベンジル、4-メトキシベンジル、3-メトキシベンジル、4-クロロベンジル、2-フェネチル、3-フェニルプロピルなどの基が挙げられる。

置換されていてもよい炭素数5～13のヘテロアリールアルキル基の好ましい例としては、4-ピリジルメチル、3-ピリジルメチル、2-ピリジルメチル、2-(ピリジン-4-イル)エチル、2-(ピリジン-3-イル)エチル、2-キノリルメチル、3-イソキノリルメチルなどの基が挙げられる。

炭素数2～11のアシル基の好ましい例としては、炭素数2～11の直鎖または分岐鎖アルキルカルボニル基、または置換されていてもよい炭素数7～11のアリールカルボニル基および炭素数4～

10のヘテロアリールカルボニル基が挙げられる。アリールカルボニル基において、置換されていてもよいアリール基とは、フェニル、ナフチル、インデニルなどの芳香族炭化水素基を表し、ヘテロアリールカルボニル基において、置換されていてもよいヘテロアリール基とは、2-ピリジル、3-ピリジル、2-ピリミジルなどの芳香族複素環基を表す（その場合、芳香環は例えばメチル、エチル、プロピルのような低級アルキル基、メトキシ、エトキシのようなアルコキシ基塩素原子やフッ素原子のようなハロゲン原子、エステル化またはアミド化されてもよいカルボキシル基などから選ばれた1～2個の置換基で置換されていてもよい）。この場合の好ましい例としてはアセチル、プロパノイル、ブタノイル、ペンタノイル、ベンゾイル、p-クロロベンゾイル、ニコチノイル、イソニコチノイル、ピコリノイルなどの基が挙げられる。

また、 R^2 において特に好ましくは、水素原子、メチル基、イソプロピル基、フェニル基、3-メトキシフェニル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、ベンジル基、3-ピリジルメチル基、4-ピリジルメチル基、アセチル基、カルボキシメチル基、メトキシカルボニルメチル基、t-ブトキシカルボニルメチル基などが挙げられる。

また、Xは、エステル化またはアミド化されていてもよいカルボキシル基を示し、エステル化またはアミド化されていてもよいカルボキシル基の好ましい例としては、基- COOR^6 （式中、 R^6 は水素原子、置換されていてもよい炭素数1～6のアルキル基、置換されていてもよい炭素数7～14のアラルキル基を示す）、基- CONR^7R^8 （式中、 R^7 および R^8 は各々独立に水素原子、置換されていてもよい炭素数1～6のアルキル基、置換されていてもよい炭素数6～12のアリール基、置換されていてもよい炭素数4～11のヘテロアリール基、置換されていてもよい炭素数7～14のアラルキル基、置換さ

れていてもよい炭素数 5 ～ 13 のヘテロアリールアルキル基を示すか、あるいは R^7 および R^8 はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、更に窒素原子、酸素原子、硫黄原子を含んでいてもよい、あるいはまた縮合していてもよい異項環基を示す)、基-CONR⁷R⁸ (式中、 R^7 および R^8 はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、置換されていてもよい炭素原子および窒素原子以外に、窒素原子、酸素原子、硫黄原子から選ばれる 1 ～ 3 個のヘテロ原子を含んでいてもよい 5 ～ 8 員環含窒素複素環基を示し、これらはその環上の炭素原子または硫黄原子がオキシド化されていてもよい) などが挙げられる。

これらの官能基における置換基 R^6 、 R^7 、 R^8 の好ましい具体例としては、以下のようなものが挙げられる。炭素数 1 ～ 6 のアルキル基としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、ヘキシルなどの直鎖または分岐鎖の飽和脂肪族炭化水素基、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどの飽和脂環式炭化水素基、およびシクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチルなどの飽和脂環式炭化水素基-脂肪族炭化水素基などが挙げられる。

また、置換された炭素数 1 ～ 6 のアルキル基としては、a) フェニル、ナフチルなどのアリール基 (その場合、芳香環は例えばメチル基、エチル基、プロピル基のようなアルキル基、塩素原子やフッ素原子のようなハロゲン原子、エステル化またはアミド化されてもよいカルボキシル基などから選ばれた 1 ～ 2 個の置換基で置換されていてもよい)、b) 2-ピリジル、3-ピリジル、2-ピリミジニルなどのヘテロアリール基、c) エステル化またはアミド化されてもよいカル

ボキシル基、d)水酸基、e)アルコキシ基、f)置換されていてもよいアミノ基、g)シアノ基からなる群から選ばれた基で置換されたアルキル基が挙げられ、特に好ましい具体例としては、例えばカルボキシメチル、メトキシカルボニルメチル、カルボキシエチル、カルバモイルメチル、2-ヒドロキシエチル、3-ヒドロキシプロピル、4-ヒドロキシブチル、2-(ジエチルアミノ)エチル、シアノメチル、シアノエチルなどの基が挙げられる。

置換されていてもよい炭素数7～14のアラルキル基の好ましい例としては、ベンジル、4-ニトロベンジル、3-ニトロベンジル、4-メトキシベンジル、3-メトキシベンジル、4-クロロベンジル、2-フェネチル、3-フェニルプロピルなどが挙げられる。

置換されていてもよい炭素数6～12のアリール基の好ましい例としては、フェニル、ナフチル、インデニルなどの芳香族炭化水素基が挙げられる。その場合、芳香環は例えばメチル、エチル、プロピル、トリフルオロメチル、シアノメチル基のような置換されていてもよいアルキル基、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ基などの置換されていてもよいアルコキシ基、水酸基、ニトロ基、アミノ、N-メチルアミノ、N,N-ジメチルアミノ、モルフォリノ、アルコキシカルバモイル基などの置換されていてもよいアミノ基、トリフルオロメタンスルホニル基、イミダゾール-1-イルや1H-ピラゾール-3-イル基などの異項環基、塩素原子やフッ素原子のようなハロゲン原子、エステル化またはアミド化されていてもよいカルボキシル基などから選ばれた1～3個の置換基で置換されていてもよい。

置換されていてもよい炭素数4～11のヘテロアリール基の好ましい例としては、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、ピリミジン-4-イルなどの芳香族複素環基が挙げられる。

その場合、芳香族複素環は例えばメチル、エチル、プロピル、トリフルオロメチル、シアノメチル基のような置換されていてもよいアルキル基、メトキシ、エトキシ、イソプロポキシ、トリフルオロメトキシ基などの置換されていてもよいアルコキシ基、水酸基、ニトロ基、アミノ、N-メチルアミノ、N,N-ジメチルアミノ、モルフォリノ、アルコキシカルバモイル基などの置換されていてもよいアミノ基、トリフルオロメタンスルホニル基、イミダゾール-1-イルや1H-ピラゾール-3-イル基などの異項環基、塩素原子やフッ素原子のようなハロゲン原子、エステル化またはアミド化されていてもよいカルボキシル基などから選ばれた1～3個の置換基で置換されていてもよい。

また、例えばアミド化されたカルボキシル基としては、基-CONR⁷ R⁸において、R⁷およびR⁸はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、更に窒素原子、酸素原子、硫黄原子を含んでいてもよい、あるいはまた縮合していてもよい異項環を表す場合、異項環基の好ましい具体例としてはピペリジノ、ピロリジノ、モルホリノ、チオモルフォリノ、ピペラジノ、ホモピペラジノなどの基が挙げられる。

これらは、その環上の炭素原子または硫黄原子がオキシド化されていてもよく、また環上に例えばメチル、エチル、プロピルのようなアルキル基、フェニル、4-メトキシフェニル、4-クロルフェニル、ナフチルのような置換されていてもよいアリール基、2-ピリジル、3-ピリジル、2-ピリミジルのような置換されていてもよいヘテロアリール基、カルボキシル基、カルバモイル、ジメチルアミノカルバモイルのような置換されてもよいカルバモイル基、ベンジル、4-クロルベンジル、2-ピリジルメチル、3-ピリジルメチルのような置換されていてもよいアラルキル基などから選ばれた1～2個の置換

基を有していてもよい。

置換されていてもよいアミノ基としては、基- NR^aR^b （式中、 R^a 、 R^b は各々独立に水素原子、置換されていてもよい炭素数1～6の低級アルキル基を示すか、 R^a 、 R^b はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、更に窒素原子、酸素原子、硫黄原子を含んでいてもよい、あるいはまた縮合していてもよい異項環基を示す）、基- NHCOR^c （式中、 R^c は水素原子、置換されていてもよい炭素数1～6の低級アルキル基、あるいは置換されていてもよい炭素数6～12のアリール基を示す）、基- $\text{NHCOCH}_2\text{NR}^d\text{R}^e$ （式中、 R^d および R^e は各々独立に水素原子、置換されていてもよい炭素数1～6のアルキル基、または置換されていてもよい炭素数6～12のアリール基を示すか、あるいは R^d および R^e はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、更に窒素原子、酸素原子、硫黄原子を含んでいてもよい、あるいはまた縮合していてもよい異項環基を示す）、基- NHSO_2R^f （式中、 R^f は置換されていてもよい炭素数1～6の低級アルキル基、あるいは置換されていてもよい炭素数6～12のアリール基を示す）、基- NR^gCOOR^h （式中、 R^g は水素原子、あるいは置換されていてもよい炭素数1～6の低級アルキル基を示し、 R^h は置換されていてもよい炭素数1～6の低級アルキル基、あるいは置換されていてもよい炭素数6～12のアリール基を示す）、基- $\text{NHCONR}^i\text{R}^j$ （式中、 R^i 、 R^j は各々独立に水素原子、置換されていてもよい炭素数1～6の低級アルキル基、あるいは置換されていてもよい炭素数6～12のアリール基を示すか、 R^i 、 R^j はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、更に窒素原子、酸素原子、硫黄原子を含んでいてもよい、あるいはまた縮合していてもよい異項環基を示す）または基- $\text{NHC(=NH)NR}^k\text{R}^l$ （式中、 R^k 、 R^l は各々独立に水素原子、あるいは置換されていてもよい炭素数1～6の低級アルキル基を示す）など

が挙げられる。

置換されていてもよい炭素数 1 ～ 6 の低級アルキル基の好ましい例としては、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペンチル、n-ヘキシルなどの炭素数 1 ～ 6 の直鎖または分岐鎖の飽和脂肪族炭化水素基、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルなどの飽和脂環式炭化水素基およびシクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロブチルメチルなどの飽和脂環式炭化水素基—脂肪族炭化水素基などなどが挙げられる。

置換されていてもよい炭素数 6 ～ 12 のアリール基の好ましい例としては、フェニル、4-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、2-メトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、4-トリフルオロメチルフェニル、4-モルフォリノフェニル、4-シアノフェニル、4-クロルフェニル、4-ニトロフェニル、1-ナフチルなどの基が挙げられる。

この場合における好ましい具体例としてはアミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、(2-ヒドロキシエチル)アミノ、(3-ヒドロキシプロピル)アミノ、(4-ヒドロキシブチル)アミノ、ジ(2-ヒドロキシエチル)アミノ、(2-ジエチルアミノエチル)アミノ、(カルボキシメチル)アミノ、ジ(カルボキシメチル)アミノ、(エトキシカルボニルメチル)アミノ、ジ(エトキシカルボニルメチル)アミノ、ベンジルアミノ、ベンジル(メチル)アミノ、アセチルアミノ、n-プロピオニルアミノ、(2-クロロアセチル)アミノ、(2-アミノアセチル)アミノ、(2-モルフォリノアセチル)アミノ、(2-ピロリジノアセチル)アミノ、(2-ピペラジノアセチル)アミノ、(2-イソブ

ロピルアミノアセチル) アミノ、(2-シクロヘキシルアミノアセチル) アミノ、(2-フェニルアミノアセチル) アミノ、ベンゾイルアミノ、(4-メチルベンゾイル) アミノ、(4-クロロベンゾイル) アミノ、(4-アミノベンゾイル) アミノ、(メトキシカルボニル) アミノ、(tert-ブトキシカルボニル) アミノ、(ベンジルオキシカルボニル) アミノ、(アミノカルボニル) アミノ、(ジメチルアミノカルボニル) アミノ、(アニリノカルボニル) アミノ、メタンスルホニルアミノ、ベンゼンスルホニルアミノ、トルエンスルホニルアミノなどの基が挙げられる。また、例えば基-NR^aR^bにおいて、R^aおよびR^bが、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、更に窒素原子、酸素原子、硫黄原子を含んでいてもよい、あるいはまた縮合していてもよい異項環基を示す場合、異項環基の好ましい具体例としてはピペリジノ、ピロリジノ、モルホリノ、チオモルフオリノ、ピペラジノ、N-メチルピペラジノ、N-フェニルピペラジノ、ホモピペラジノなどの基が挙げられる。

置換されていてもよい炭素数4～11のヘテロアリール基の好ましい例としては、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジル、2-フラニル、2-チエニル、2-ピリミジニル、2-キノリル、3-イソキノリルなどの基が挙げられる。

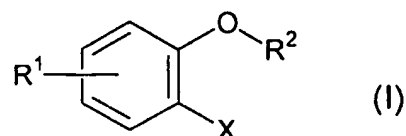
置換されていてもよい炭素数7～14のアラルキル基の好ましい例としては、ベンジル、4-ニトロベンジル、3-ニトロベンジル、4-メトキシベンジル、3-メトキシベンジル、4-クロロベンジル、2-フェネチル、3-フェニルプロピルなどが挙げられる。

置換されていてもよい炭素数5～13のヘテロアリールアルキル基の好ましい例としては、4-ピリジルメチル、3-ピリジルメチル、2-ピリジルメチル、2-(ピリジン-4-イル)エチル、2-(ピリジン-3-イル)エチル、2-キノリルメチル、3-イソキノリルメチルなどの基

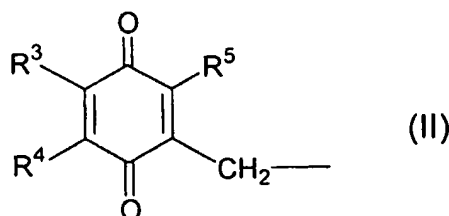
が挙げられる。

ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子またはヨウ素原子である。

また、本発明における好ましい化合物としては、次の一般式（I）において、



式中、R¹が、下記の一般式（II）



（式中、R³およびR⁴がメチル基またはメトキシ基、R⁵がメチル基を示す）であり；R²が水素原子、メチル基、イソプロピル基、フェニル基、3-メトキシフェニル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、ベンジル基、3-ピリジルメチル基、4-ピリジルメチル基、アセチル基、カルボキシメチル基、メトキシカルボニルメチル基、t-ブトキシカルボニルメチル基であり；Xは、エステル化またはアミド化されていてもよいカルボキシル基である）

化合物が挙げられ、特に好ましい具体的化合物としては、下記の化合物が挙げられる。

4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸、

6-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキ

シ安息香酸、

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸、

3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸、

N-[4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシベンゾイル]ピペリジン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシベンゾイル]ピペリジン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシベンゾイル]モルフォリン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸、

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸、

3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸、

4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-アセトキシ安息香酸、

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-アセトキシ安息香酸、

3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-アセトキシ安息香酸、

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸メチルエステル、

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-メトキシ安息香酸、

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-イソプロポキシ安息香酸、

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-フェノキシ安息香酸メチルエステル、

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-メトキシフェノキシ)安息香酸メチルエステル、

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸メチルエステル、

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジルメチルオキシ)安息香酸メチルエステル、

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(*t*-ブトキシカルボニルメチルオキシ)安息香酸メチルエステル、

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-フェノキシ安息香酸、

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-メトキシフェノキシ)安息香酸、

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸、

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジルメチルオキシ)安息香酸、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンゾイル]ピペリジン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンゾイル]モルフォリン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジ

ルメチルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジ
ルメチルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジ
ルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジ
ルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(メトキシ
カルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-t-ブト
キシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジ
ルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジ
ルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジ
ルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジ
ルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(メトキシ
カルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン、

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(t-ブトキ
シカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン、

4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-
2-ベンジルオキシ安息香酸、

6-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-
2-ベンジルオキシ安息香酸、

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-
2-ベンジルオキシ安息香酸、

3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-
2-ベンジルオキシ安息香酸、

4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-
2-アセトキシ安息香酸、

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-
2-アセトキシ安息香酸、

3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-
2-アセトキシ安息香酸、

4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-
2-ヒドロキシ安息香酸、

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-
2-ヒドロキシ安息香酸、

3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-
2-ヒドロキシ安息香酸、

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-
2-メトキシ安息香酸、

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-
2-イソプロポキシ安息香酸、

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-
2-フェノキシ安息香酸、

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-
2-(3-メトキシフェノキシ)安息香酸、

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-
2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸、

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-

2-(4-ピリジルメチルオキシ)安息香酸、

N-[4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル] ピペリジン、

N-[4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル] モルフォリン、

N-[4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-[6-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル] ピペリジン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル] モルフォリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル] ピペリジン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル] モルフォリン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-[4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル] ピペリジン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル] モルフォリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル] ピペリジン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル] モルフォリン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル] ピペリジン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル] モルフォリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル] ピペリジン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル] モルフォリン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-メトキシベンゾイル]- ピペリジン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-メトキシベンゾイル]- モルフォリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-メトキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチ

ル-2-イソプロポキシベンゾイル] ピペリジン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-イソプロポキシベンゾイル] モルフォリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-イソプロポキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-フェノキシベンゾイル] ピペリジン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-フェノキシベンゾイル] モルフォリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-フェノキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-メトキシフェノキシ)ベンゾイル] ピペリジン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-メトキシフェノキシ)ベンゾイル] モルフォリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-メトキシフェノキシ)ベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル] ピペリジン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル] モルフォリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-4-メトキシアニリン

、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(4-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル] ピペリジン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチ

ル-2-(4-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル] モルフォリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(4-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(4-ピリジルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(4-ピリジルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(メトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル)]ピペリジン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(メトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(t-ブトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(t-ブトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-3,4-ジメトキシアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル

ル-2-アセトキシベンゾイル]-3,4,5-トリメトキシアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-アセチルアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-クロロアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-モルフォリノアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-シアノアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-3,5-ビストリフルオロメチルアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-3,4-ジメトキシアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-3,4,5-トリメトキシアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-アセチルアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-クロロアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-モルフォリノアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-シアノアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチ

ル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-3,5-ビストリフルオロメチルアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-(S)-1-フェニルエチルアミン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-(R)-1-フェニルエチルアミン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-フェノキシベンゾイル]-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-フェノキシベンゾイル]-2-メチルピペリジン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-4-メチルピペリジン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-3,4,5-トリメトキシアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-4-アセチルアニリン、

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(*t*-ブトキシカルボニルメチルオキシ)安息香酸メチルエステル、

N-(6-クロロピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,

4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-(2-クロロピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(2-クロロピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-(6-メトキシピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(6-メトキシピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-[4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-(トリフルオロメチルスルホニル)アニリン、

N-[4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-(トリフルオロメチルスルホニル)アニリン、

N-(ピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(ピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-(ピリジン-4-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-フルオロアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-フルオロアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-3-ニトロアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-3-ニトロアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-2-トリフルオロメチルアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-2-トリフルオロメチルアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸 エチルエステル

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸 エチルエステル

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-シアノメチルアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-シアノメチルアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-3-トリフルオロメチルアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-3-トリフルオロメチルアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-2-ニトロアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-2-ニトロアニリン、

N-(ピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(ピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾ

キノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-(ピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ
ン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-(ピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ
ン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-シクロプロピル-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ
ン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-シクロプロピル-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ
ン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-シクロヘキシル-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ
ン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-シクロヘキシル-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ
ン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-メチル-N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ
ン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-メチル-N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ
ン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ
ン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ
ン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ
ン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-4-アミノ安息香酸
エチルエステル、

N-(ピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ
ン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンズアミド

、

N-(ピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンズアミド、

N-シクロプロピル-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンズアミド、

N-シクロヘキシル-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンズアミド、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-(トリフルオロメチルスルホニル)アニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-(トリフルオロメチルスルホニル)アニリン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-(トリフルオロメチルスルホニル)アニリン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-2,4-ジクロロアニリン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-2,4-ジクロロアニリン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-モルホリノアニリン、

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-モルホリノアニリン、

N-(6-メトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(6-メトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-(2,6-ジメトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(2,6-ジメトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-(6-クロロピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(6-クロロピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸 t-ブチルエステル、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-ニトロアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメトキ

シアニリン、

N-(3-t-ブトキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(3-ヒドロキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(3-ヒドロキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-(5-t-ブトキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(5-ヒドロキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(5-ヒドロキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-t-ブトキシカルボニルアミノアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-t-ブトキシカルボニルアミノアニリン、

N-(ピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(ピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド (メタンサルホン酸塩)、

N-(ピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド (メタンサルホン酸塩)、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-p-フェニレンジアミン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-p-フェニレンジアミン (塩酸塩)、

N-(ピリジン-3-イル)-3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(ピリジン-3-イル)-3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-(イミダゾール-1-イル)アニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-(イミダゾール-1-イル)アニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-(1H-ピラゾール-3-イル)アニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-(1H-ピラゾール-3-イル)アニリン、

N-メチル-N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン、

N-メチル-N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸 t-ブチルエステル、

N-(2-メトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(2-メトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-(2-ジメチルアミノピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(2-ジメチルアミノピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-2,5-ジメトキシアニリン、

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-2,5-ジメトキシアニリン、

N-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-メトキシベンズアミド、

N-(2-モルホリノピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、

N-(2-モルホリノピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

N-(6-モルホリノピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチ

ル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、
N-(6-モルホリノピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、
N-(2-クロロピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、
N-(2-クロロピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、
N-(6-メトキシピリミジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、
N-(6-メトキシピリミジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、
N-(2-メトキシピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、
N-(2-メトキシピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、
5-(2,5-ジメトキシ-3,4,6-トリメチルベンジル)-2-アセトキシ安息香酸、
5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸、
N-[5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン、
N-[5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン、
N-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド、
N-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド、

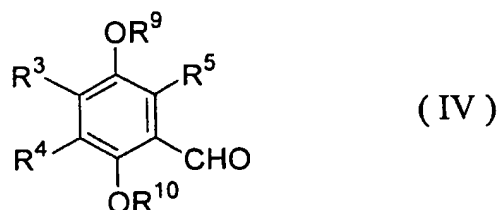
N-(ピリジン-4-イル)-5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド。

次に、本発明を実施するための化合物の製造法の例を説明する。
しかし、本発明の有効成分である化合物の製造方法はこれらに限定されるものではない。

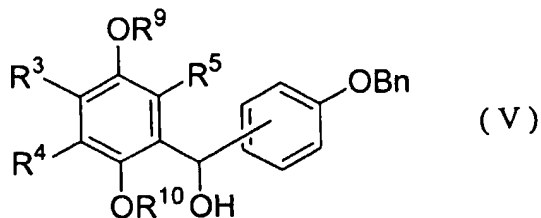
[一般製法]

本発明の有効成分として用いられる一般式 (I) で示される置換安息香酸誘導体は、それ自体公知の方法、即ち論文 (Suzuki, K., Tatsuoka, T., Ishihara, T., Ogino, R., Miyazaki, T., Satoh, F., Miyano, S., Sumoto, K., Chem. Pharm. Bull., (1997) 45, 668-674.) 記載の方法およびこれらに準じた方法に従って製造可能な合成中間体を用いて製造できる。

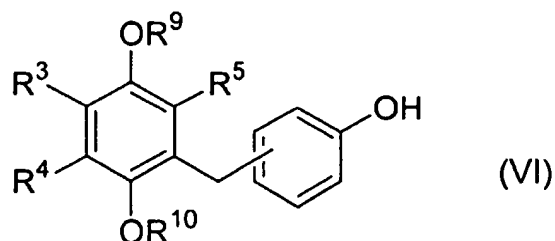
具体的には、一般式 (IV) :



(式中、 $R^3 \sim R^5$ 、 R^9 および R^{10} は前記定義の通りである) で表わされるアルデヒド化合物を、ハロゲン化フェノール誘導体から調製されるグリニャール試薬または有機リチウム試薬と反応させることにより、一般式 (V) :

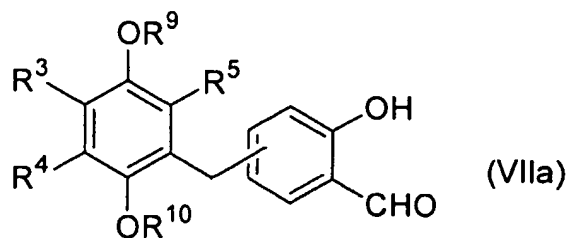


(式中、 $R^3 \sim R^5$ 、 R^9 および R^{10} は前記定義の通りであり、Bnは置換されていてもよいベンジル基を表わす)を得、この化合物をルイス酸またはトリメチルシリルトリフルオロメタンスルフォネートなどの触媒の存在下、トリエチルシランなどの還元剤で還元した後、パラジウム-炭素などの触媒の存在下、水素気流下で攪拌することにより接触還元し、一般式(VI)：



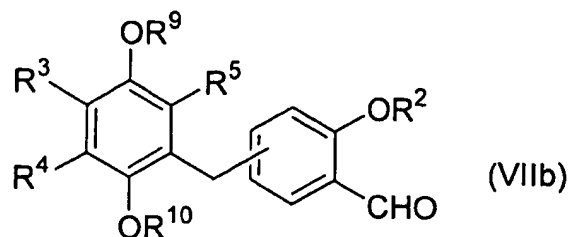
(式中、 $R^3 \sim R^5$ 、 R^9 および R^{10} は前記定義の通りである)で表わされるフェノール誘導体を得る。

該化合物を例えばトリフルオロ酢酸などの溶媒中、ヘキサメチレンテトラミンと、室温～100℃の温度で攪拌した後、さらに加水分解することにより、一般式(VIIa)：



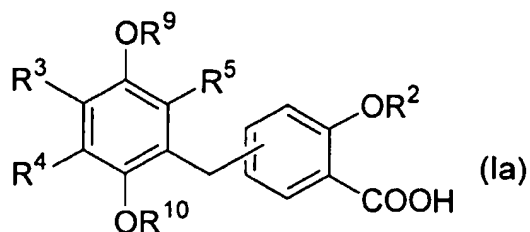
(式中、 $R^3 \sim R^5$ 、 R^9 および R^{10} は前記定義の通りである)を得る。

次に、該化合物を、アセトンなどの反応に関与しない溶媒中、炭酸カリウム、水酸化ナトリウムなどの塩基の存在下、ジメチル硫酸、臭化ベンジルなどのアルキル化剤と、室温～50℃の温度で攪拌することにより、一般式(VIIb)：



(式中、 $R^3 \sim R^5$ 、 R^9 および R^{10} は前記定義の通りであり、 R^2 は炭素数1～6の低級アルキル基、炭素数7～14のアラルキル基を表わす)で表わされる化合物を得る。

該化合物を、例えばアセトニトリルなどの反応に関与しない溶媒に溶解し、磷酸緩衝液との混合液中で、亜塩素酸ナトリウムと過酸化水素水などの酸化剤の存在下、0～50℃の温度で攪拌することにより、一般式(Ia)：

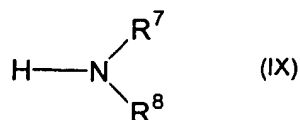


(式中、 $R^3 \sim R^5$ 、 R^9 および R^{10} は前記定義の通りであり、 R^2 は炭素数1～6の低級アルキル基、炭素数7～14のアラルキル基を表わす)で表わされる置換安息香酸誘導体を得る。

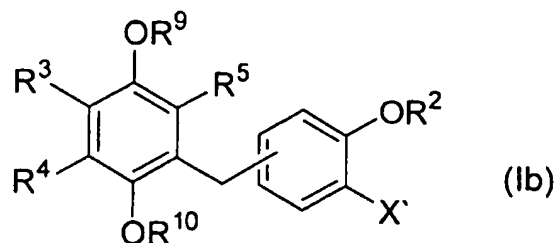
次に、このカルボン酸化合物を、メタノールなどの反応に関与しない溶媒中でジアゾメタン、トリメチルシリルジアゾメタンなどで処理するか、塩化メチレンなどの反応に関与しない溶媒中で、4-ジメチルアミノピリジンなどの触媒の存在下または非存在下に、1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩などの脱水縮合剤を用いるか、または、塩化オキサリルなどで酸クロリド体として、一般式(VIII)：



(式中、 R^6 は炭素数1～6の低級アルキル基、炭素数7～14のアラルキル基を表わす)で表わされるアルコール類、または一般式 (IX) :

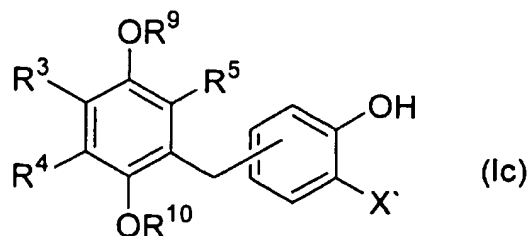


(式中、 R^7 および R^8 は前記定義の通りである)で表わされるアミン類と縮合することにより、一般式 (Ib) :



(式中、 $R^2 \sim R^5$ 、 R^9 および R^{10} は前記定義の通りであり； X' は、エステル化またはアミド化されたカルボキシル基を示す)で表わされる化合物を得る。

また、一般式 (Ib) において、 R^2 が置換されていてもよいベンジル基である化合物を、パラジウム-炭素などの触媒の存在下、水素気流下で室温～50℃で攪拌することにより、一般式 (Ic) :



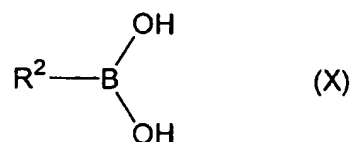
(式中、 $R^3 \sim R^5$ 、 R^9 、 R^{10} および X' は前記定義の通りである)

で表される化合物を得ることが出来る。

該化合物(Ic)は、

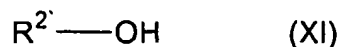
1) アセトンなどの反応に関与しない溶媒中で、炭酸カリウムなどの塩基の存在下に、ハロゲン化アルキルなどのアルキル化剤と0 ~ 100 °C の温度で攪拌するか、

2) 塩化メチレン、アセトニトリルなどの反応に関与しない溶媒中で、酢酸銅などの触媒の存在する条件で、次の一般式(X) :

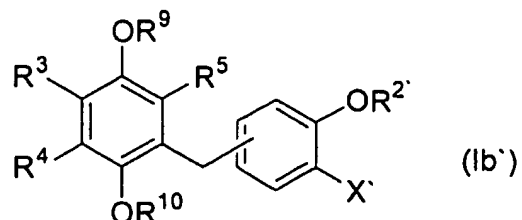


(式中、R²は置換されていてもよいアリール基、または置換されていてもよいヘテロアリール基を表わす) で表わされるボロン酸誘導体と攪拌するか、

3) テトラヒドロフランなどの反応に関与しない溶媒中で、一般的な光延反応(またはその改良法)の条件、例えばトリフェニルフォスフィン(またはトリブチルフォスフィン)とジエチルアゾジカルボキシレート(またはN,N,N',N'-テトラメチルアゾジカルボキシレート)の存在する条件で、一般式(XI) :

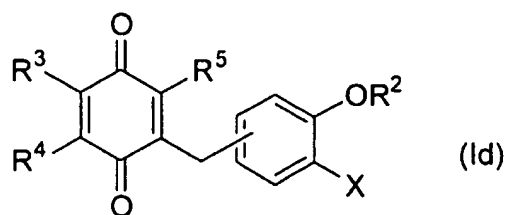


(式中、R^{2'}は置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいアラルキル基、置換されていてもよいヘテロアリールアルキル基を表わす) で表されるアルコール類と攪拌することにより、一般式(Ib') :



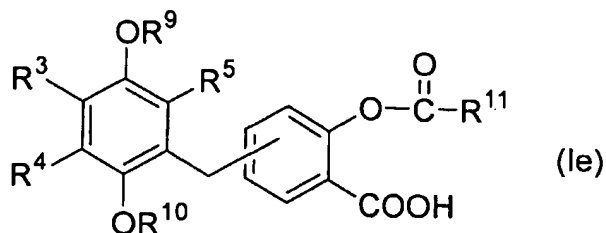
(式中、 $R^{2'}$ は置換されていてもよい炭素数 1 ～ 6 の低級アルキル基、置換されていてもよい炭素数 6 ～ 12 のアリール基、置換されていてもよい炭素数 4 ～ 11 のヘテロアリール基、置換されていてもよい炭素数 7 ～ 14 のアラルキル基または置換されていてもよい炭素数 5 ～ 13 のヘテロアリールアルキル基を表わし、 $R^3 \sim R^5$ 、 R^9 、 R^{10} および X' は前記定義の通りである) で表される化合物を得ることが出来る。

上記化合物 (Ia)、(Ib) および (Ib') を、アセトニトリルと水との混合溶媒などの反応に関与しない溶媒中、硝酸第二セリウムアンモニウムなどの酸化剤で酸化することにより一般式 (Id) :



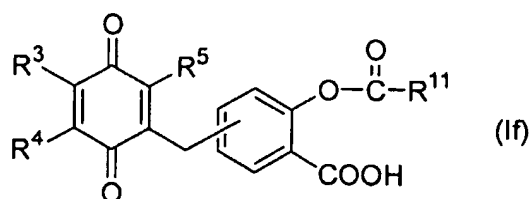
(式中、 $R^2 \sim R^5$ および X は前記定義の通りである) で表わされるベンゾキノン誘導体を得ることができる。

また、前記の一般式 (Ia) において、 R^2 が置換されていてもよいベンジル基である化合物を、パラジウム-炭素などの触媒の存在下、水素気流下で室温～50℃で攪拌することにより脱ベンジル化した後、例えば無水酢酸、無水安息香酸などのアシル化剤と反応をおこなうことにより、一般式 (Ie) :

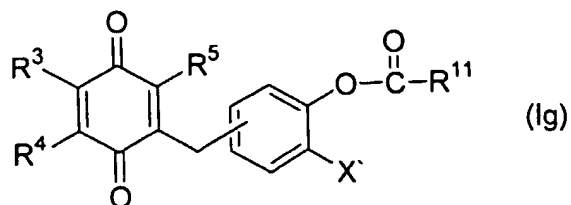


(式中、 $R^3 \sim R^5$ 、 R^9 および R^{10} は前記定義の通りであり、 R^{11} は置換されていてもよい炭素数 1 ～ 6 の低級アルキル基、置換されていてもよい炭素数 6 ～ 12 のアリール基を表わす) で表わされる化合物を得る。

該化合物は、アセトニトリルと水との混合溶媒などの反応に関与しない溶媒中、硝酸第二セリウムアンモニウムなどの酸化剤で酸化することにより一般式 (If) :



(式中、 $R^3 \sim R^5$ および R^{11} は前記定義の通りである) で表されるカルボン酸化合物を得ることが出来る。次に、このカルボン酸化合物を、塩化メチレンなどの反応に関与しない溶媒中で、4-ジメチルアミノピリジンなどの触媒の存在下または非存在下に、脱水縮合剤を用いてアルコール類、またはアミン類と縮合することにより、一般式 (Ig) :



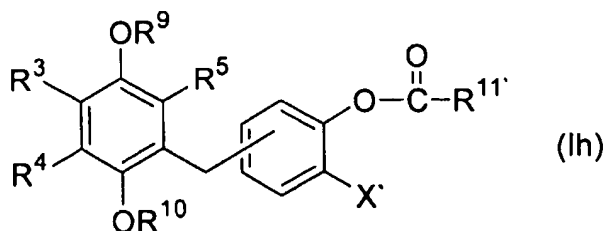
(式中、 $R^3 \sim R^5$ および R^{11} は前記定義の通りであり； X' は、エステル化またはアミド化されたカルボキシル基を示す) で表わされる化合物を得る。

また、前記の一般式 (Ic) を、

1) ピリジンやトリエチルアミンなどの塩基の存在下、無水酢酸などの酸無水物と反応するか、

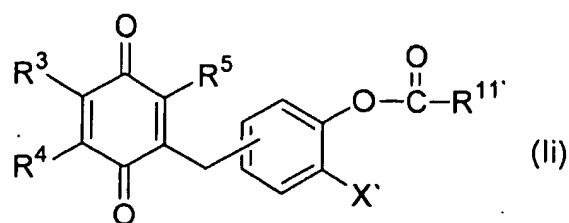
2) 4-ジメチルアミノピリジンなどの触媒の存在下または非存在下に、脱水縮合剤を用いて、置換されていてもよい安息香誘導体やニコチン酸、ピコリン酸などの複素環カルボン酸誘導体と縮合するか、

3) ピリジンやトリエチルアミンなどの塩基の存在下、塩化アセチル、塩化ベンゾイルなどの酸クロリド体と反応することにより、一般式 (Ih) :



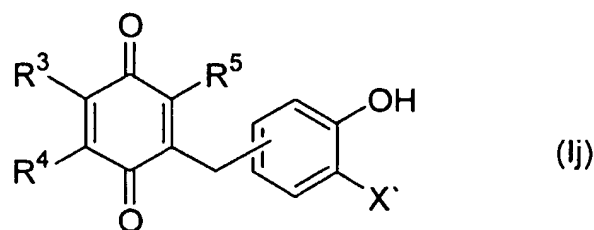
(式中、 $R^3 \sim R^5$ 、 R^9 および R^{10} は前記定義の通りであり、 R^{11} は置換されていてもよい炭素数 1 ~ 6 の低級アルキル基、置換されていてもよい炭素数 6 ~ 12 のアリール基、または置換されていてもよい炭素数 4 ~ 11 のヘテロアリール基を表わし； X' は、エステル化またはアミド化されたカルボキシル基を示す) を得る。

該化合物は、アセトニトリルと水との混合溶媒などの反応に関与しない溶媒中、硝酸第二セリウムアンモニウムなどの酸化剤で酸化することにより一般式 (Ii) :



(式中、 $R^3 \sim R^5$ 、 $R^{11'}$ および X' は前記定義の通りである) を得る。

また、化合物 (Ig) 及び (Ii) を、メタノールなどの反応に関与しない溶媒中で、炭酸水素ナトリウム水溶液などの塩基の共存下に攪拌して加水分解することにより、一般式 (Ij) :



(式中、 $R^3 \sim R^5$ および X' は前記定義の通りである) で表される化合物を得ることが出来る。

一般式 (Ia ~ Ij) で表される本発明に係る物質は、NF- κ B の活性化を抑制することができるため、NF- κ B の活性化に起因する疾患、例えば種々の炎症性メディエーターの過剰産生やウイルスの増殖に起因する疾病に対する予防薬、治療薬としての有用性が期待できる。具体的には、例えば、NO や TNF- α の過剰産生が発症原因と考えられる疾患、敗血症ショック、変形性関節症、慢性関節リウマチ、悪液質、多臓器不全、炎症性腸疾患、マラリア、後天性免疫不全症候群、ヒト T 細胞白血病、髄膜炎、肝炎、心筋炎、II 型糖尿病、多発性硬化症、ベーチェット病、全身性エリテマトーデス、虚血性心疾患などに対する治療薬および予防薬として有用である。

本発明に係る化合物を上記の医薬組成物として使用する場合、例

えば、錠剤、カプセル剤、エリキシル剤、マイクロカプセル剤などの剤形で経口的に、あるいは水若しくはそれ以外の薬学的に許容し得る液との溶液、または懸濁液剤などの注射剤の形で非経口的に使用できる。例えば、当該化合物と、生理学的に認められる担体、香味剤、賦形剤、安定剤などとを、一般に認められた形態で混和することによって製造することができる。錠剤などに混和することができる添加剤としては、例えば、ゼラチンのような結合剤、コーンスターチのような膨化剤、結晶性セルロースのような賦形剤、ステアリン酸マグネシウムのような潤滑剤などを用いることができる。カプセルの剤形である場合には、前述の組成物に更に液状担体を含有することができる。注射のための無菌組成物も、通常の処方を用いることができる。

注射剤の水溶液としてはブドウ糖などを含む等張液などが挙げられ、ポリエチレングリコールのような適当な溶解補助剤などと併用してもよい。また、緩衝剤、安定剤、保存剤、酸化防止剤、無痛化剤などを配合してもよい。このようにして得られる製剤は、例えば、ヒトをはじめとする哺乳動物に対して投与することができる。投与量は、症状などにより差異はあるが、経口投与の場合、一般的に成人においては1日につき約0.01~100 mg、好ましくは約0.1~50 mg、より好ましくは約1.0~25 mgである。非経口的に投与する場合は、例えば、注射剤の場合、一般的に成人においては1日につき約0.001~50 mg程度、好ましくは約0.01~25 mg、より好ましくは約0.1~10 mg程度を静脈注射により投与するのが好ましい。

NF- κ B阻害効果は、NF- κ Bの活性化によって制御されている遺伝子の発現を直接、または間接的に測定することにより調べることができる。

また、炎症性蛋白質の過剰発現を抑制する効果は、IL-1やTNF- α

などのサイトカインやリポ多糖などで細胞もしくは動物固体を刺激することによって、培養液または体液中に上昇してくる炎症性蛋白質量を直接もしくは間接的に測定することで調べることができる。また、広義の抗炎症作用を確認する方法としては、カラゲニンやデキストランなどにより惹起された浮腫を抑制する効果で調べることができる。

これらのモデルにおいてはNOやTNF- α の産生を抑制することが有効であることが確認されている (Filion, M.C. and Phillips, N.C. (1997) Br. J. Pharmacol., 122, 551-557.; Tsao, P.W., Suzuki, T., Totsuka, R., Murata, T., Takagi, T., Ohmachi, Y., Fujiwara, H., and Takata, I. (1997) Clin. Immunol. Immunopathol. (1997) 83, 173-178.; Cuzzocrea, S., Zingarelli, B., Hake, P., Salzman, A.L. and Szabo, C. Free Radic. Biol. Med. (1998) 24, 450-459) 。

さらに、具体的な疾患に対しては、敗血症治療薬としての効果は、マウスなどの動物にリポ多糖を投与し、生存率を改善する効果や、血中の炎症性サイトカインの量を測定することにより判断することができる。慢性関節リウマチ治療薬としての効果は、アジュバントやコラーゲンにより惹起された関節炎のモデル動物で薬効を評価することができる (Y. Iigo et al., J. Immunol., (1991) 147, 4167) 。

また、難治性炎症、例えばクローン病、肝炎、腎炎に対する治療薬としての効果は、それ自体公知かまたはその方法に準じた方法に従って作製した動物モデルで薬効を推定することができる (K. Nishikawa et al., J. Exp. Med., (1994) 180, 95; K. Kawasaki et al., J. Immunol., (1992) 150, 1074) 。

さらに、臓器移植拒絶反応抑制剤としての効果は、例えばGVH(Graft versus Host)病や各種

の臓器移植モデル動物で薬効を評価することができる (A. B. Cosimi et al, J. Immunol., (1990) 142, 2617; M. Isobe et al, Science, (1992) 255, 1125)。

このように、NF- κ B阻害剤の疾患治療薬としての効果は、公知の方法またはそれに準じた方法により作製可能な各種のモデル動物によって確認することができる。

次に、実施例および実験例を挙げて本発明を更に説明するが、本発明はこれらの実施例および実験例に限定されるものではない。

参考例1. 3-(ベンジルオキシ)ブロモベンゼン

3-ブロモフェノール (50 g, 0.289 mol) をアセトン (500 ml) に溶解し、無水炭酸カリウム (80 g, 0.580 mmol) および臭化ベンジル (59 g, 0.345 mol) を順次加え、3時間加熱還流した。反応混合物を濾過し、濾液を減圧下に濃縮した。得られた粗生成物を再結晶 (ヘキサンを溶媒として用いて、2回再結晶操作をおこなった) し、標題化合物 (45.0 g, 0.171 mol, 59 %) を得た。

参考例2. 4-(ベンジルオキシ)ブロモベンゼン

4-ブロモフェノール (100 g, 0.587 mol) をアセトン (1100 ml) に溶解し、無水炭酸カリウム (159.53 g, 1.156 mmol) および臭化ベンジル (103.78 g, 0.607 mol) を順次加え、3時間加熱還流した。反応混合物を濾過し、濾液を減圧下に濃縮した。得られた粗生成物を再結晶 (ヘキサンを溶媒として用いて再結晶操作をおこなった) し、標題化合物 (120.76 g, 0.459 mol, 79 %) を得た。

参考例3. 2-(ベンジルオキシ)ブロモベンゼン

2-ブロモフェノール (50.0 g, 0.289 mol) をアセトン (400 ml) に溶解し、無水炭酸カリウム (79.89 g, 0.578 mmol) および臭化ベンジル (59.32 g, 0.347 mol) を順次加え、3時間加熱還流した。反応混合物を濾過し、濾液を減圧下に濃縮した。得られた粗生成物をシ

リカゲルカラムクロマトグラフィー (hexane:AcOEt=95:5) で精製し、標題化合物 (30.0 g, 0.114 mol, 40 %) を得た。

参考例4. 1-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルフェニル)-1-(3-ベンジルオキシフェニル)メタノール

氷冷下、3-(ベンジルオキシ)プロモベンゼン (18.4 g, 0.070 mol) とマグネシウム (1.87 g, 0.077 mol) から調製したグリニャール試薬 (150 ml テトラヒドロフラン溶液) に、3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンズアルデヒド (14 g, 0.058 mol) の無水テトラヒドロフラン (50 ml) 溶液を滴下した後、さらに2時間攪拌した。反応液を飽和塩化アンモニウム水溶液にあげ、エーテル抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄後、乾燥した。反応液を濾過し、濾液を濃縮することにより得た粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル=4:1) で精製し、標題化合物 (23.5 g, 0.055 mol, 95 %) を得た。

参考例5. 1-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルフェニル)-1-(4-ベンジルオキシフェニル)メタノール

氷冷下、4-(ベンジルオキシ)プロモベンゼン (8.00 g, 0.030 mol) とマグネシウム (0.81 g, 0.033 mol) から調製したグリニャール試薬 (30 ml テトラヒドロフラン溶液) に、3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンズアルデヒド (3.65 g, 0.015 mol) の無水テトラヒドロフラン (20 ml) 溶液を滴下した後、さらに2時間攪拌した。反応液を飽和塩化アンモニウム水溶液にあげ、エーテル抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄後、乾燥した。反応液を濾過し、濾液を濃縮することにより得た粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル=4:1) で精製し、標題化合物 (5.93 g, 0.014 mol, 92 %) を得た。

参考例6. 1-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルフェニル)-1-(2-

ベンジルオキシフェニル)メタノール

氷冷下、2-(ベンジルオキシ)プロモベンゼン(11.50 g, 0.044 mol)とマグネシウム(1.16 g, 0.048 mol)から調製したグリニャール試薬(35 ml テトラヒドロフラン溶液)に、3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンズアルデヒド(5.00g, 0.021 mol)の無水テトラヒドロフラン(30 ml)溶液を滴下した後、さらに2時間攪拌した。反応液を飽和塩化アンモニウム水溶液にあげ、エーテル抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄後、乾燥した。反応液を濾過し、濾液を濃縮することにより得た粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=4:1)で精製し、標題化合物(8.80 g, 0.021 mol, 99 %)を得た。

参考例7. 3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)フェノール

トリエチルシラン(8.33 g, 71.64 mmol)およびTMSOTf(2.65 g, 11.92 mmol)の塩化メチレン溶液(1000 ml)に、参考例4で得た化合物(25.3 g, 59.67 mmol)の塩化メチレン溶液を滴下し、室温で1時間攪拌した。反応液を水洗、乾燥した後、溶媒を留去した。残査をエタノール(100 ml)およびジオキサン(150 ml)に溶解し、5% Pd-C(3 g)のエタノール懸濁液(50 ml)に加えた後、水素気流下で室温にて16時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を濃縮して得られた残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=3:1)で精製し、標題化合物(18.4 g, 57.9 mmol, 97 %)を得た。

参考例8. 4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)フェノール

トリエチルシラン(0.99 g, 8.52 mmol)およびTMSOTf(0.31 g, 1.39 mmol)の塩化メチレン溶液(80 ml)に、参考例5で得た化合物

(3.00 g, 7.08 mmol)の塩化メチレン溶液(70 ml)を滴下し、室温で1時間攪拌した。反応液を水洗、乾燥した後、溶媒を留去した。残渣をエタノール (50 ml) に溶解し、5% Pd-C(500 mg)のエタノール懸濁液 (250 ml)に加えた後、水素気流下で室温にて16時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル=4：1) で精製し、標題化合物 (1.96 g, 6.15 mmol, 87 %)を得た。

参考例9. 2-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)フェノール

トリエチルシラン (2.95 g, 25.43 mmol)およびTMSOTf (0.94 g, 4.23 mmol)の塩化メチレン溶液 (150 ml)に、参考例6で得た化合物 (9.00 g, 21.23 mmol)の塩化メチレン溶液(130 ml)を滴下し、室温で1時間攪拌した。反応液を水洗、乾燥した後、溶媒を留去した。残渣をエタノール (50 ml) に溶解し、5% Pd-C(1.5 g)のエタノール懸濁液 (350 ml)に加えた後、水素気流下で室温にて16時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル=4：1) で精製し、標題化合物 (5.67 g, 17.83 mmol, 84 %)を得た。

参考例10. 4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンズアルデヒド(A)及び6-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンズアルデヒド(B)

3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)フェノール (11.17 g, 35.13 mmol)およびヘキサメチレンテトラミン (6.39 g, 0.046 mol)をトリフルオロ酢酸 (100 ml)に溶解し、80℃で4時間加熱攪拌した。反応終了後、溶媒を留去して得た残渣に水 (100 ml)を加えて30分間攪拌し、塩化メチレンで抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロ

マトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝9：1）で精製し、標題化合物 A（3.35 g, 9.68 mmol, 28 %）および B（2.03 g, 18 %）を得た。

参考例11. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンズアルデヒド

4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)フェノール（14.5 g, 45.60 mmol）およびヘキサメチレンテトラミン（8.30 g, 59.29 mmol）をトリフルオロ酢酸（100 ml）に溶解し、80 °Cで4時間加熱攪拌した。反応終了後、溶媒を溜去して得た残渣に水（100 ml）を加えて30分間攪拌し、塩化メチレンで抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒を溜去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝4:1）で精製し、標題化合物（12.20 g, 35.26 mmol, 78 %）を得た。

参考例12. 3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンズアルデヒド

2-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)フェノール（8.64 g, 27.17 mmol）およびヘキサメチレンテトラミン（5.00 g, 35.67 mmol）をトリフルオロ酢酸（100 ml）に溶解し、80 °Cで4時間加熱攪拌した。反応終了後、溶媒を溜去して得た残渣に水（100 ml）を加えて30分間攪拌し、塩化メチレンで抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒を溜去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝4:1）で精製し、標題化合物（2.50g, 7.23 mmol, 27 %）を得た。

参考例13. 4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシベンズアルデヒド

4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンズアルデヒド（743 mg, 2.14 mmol）をアセトン（50 ml）に溶解し

、無水炭酸ナトリウム (593 mg, 4.30 mmol) および臭化ベンジル (477 mg, 2.79 mmol) を加えた後、室温で 16 時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) で精製し、標題化合物 (864 mg, 1.98 mmol, 93 %) を得た。

参考例 14. 6-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシベンズアルデヒド

6-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンズアルデヒド (187 mg, 0.54 mmol) をアセトン (20 ml) に溶解し、無水炭酸ナトリウム (149 mg, 1.08 mmol) および臭化ベンジル (120 mg, 0.70 mmol) を加えた後、室温で 16 時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) で精製し、標題化合物 (221 mg, 0.51 mmol, 94 %) を得た。

参考例 15. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシベンズアルデヒド

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンズアルデヒド (0.100 g, 0.290 mmol) をアセトン (10 ml) に溶解し、無水炭酸ナトリウム (0.080 g, 0.579 mmol) および臭化ベンジル (0.059 g, 0.347 mmol) を加えた後、3 時間加熱還流した。反応液を濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 4 : 1) で精製し、標題化合物 (0.114 g, 0.261 mmol, 90 %) を得た。

参考例 16. 3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシベンズアルデヒド

3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンズアルデヒド (1.16 g, 3.35 mmol) をアセトン (5 ml) に溶解し、

無水炭酸ナトリウム (1.02 g, 7.38 mmol) および臭化ベンジル (0.69 g, 4.02 mmol) を加えた後、3時間加熱還流した。反応液を濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 2:1) で精製し、標題化合物 (1.45 g, 3.32 mmol, 99 %) を得た。

参考例17. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-メトキシベンズアルデヒド

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンズアルデヒド (0.500 g, 1.45 mmol) をエタノール (15 ml) に溶解し、水酸化ナトリウム (0.064 g, 1.59 mmol)、ジメチル硫酸 (0.200 g, 1.59 mmol) を順次加え、室温で12時間攪拌した。反応終了後、冷希塩酸水にあげ、酢酸エチルで抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒を溜去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 4:1) で精製し、標題化合物 (0.359 g, 0.998 mmol, 69 %) を得た。

参考例18. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-イソプロポキシベンズアルデヒド

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンズアルデヒド (0.500 g, 1.45 mmol) をDMF (15 ml) に溶解し、無水炭酸カリウム (0.359 g, 2.60 mmol) および臭化イソプロピル (0.320 g, 2.60 mmol) を順次加え、3時間加熱還流した。反応混合物を濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 4:1) で精製し、標題化合物 (0.530 g, 1.37 mmol, 94 %) を得た。

実施例1. 4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸

4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキ

シベンズアルデヒド (735 mg, 1.69 mmol) のアセトニトリル溶液 (5 ml) に、リン酸二水素ナトリウム (157 mg, 1.31 mmol) 水溶液 (2 ml)、亜塩素酸ナトリウム (795 mg, 80 %, 7.07 mmol) 水溶液 (7 ml) および過酸化水素水 (0.5 ml, 30 %) を加えた後、室温で 16 時間攪拌した。反応液を水で希釈した後、酢酸エチルで抽出した。抽出液は、10 % ハイドロサルファイトナトリウム ($\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_4$) 水溶液 および飽和食塩水で洗浄し、乾燥後、濃縮することにより標題化合物 (603 mg, 1.33 mmol, 79 %) を得た。

実施例 2. 6-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸

6-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシシベンズアルデヒド (112 mg, 0.26 mmol) のアセトニトリル溶液 (2.5 ml) に、リン酸二水素ナトリウム (24 mg, 0.20 mmol) 水溶液 (1 ml)、亜塩素酸ナトリウム (123 mg, 80 %, 1.09 mmol) 水溶液 (3.5 ml) および過酸化水素水 (0.08 ml, 30 %) を加えた後、室温で 16 時間攪拌した。反応液を水で希釈した後、酢酸エチルで抽出した。抽出液は、10 % ハイドロサルファイトナトリウム ($\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_4$) 水溶液 および飽和食塩水で洗浄し、乾燥後、濃縮することにより標題化合物 (106 mg, 0.23 mmol, 91 %) を得た。

実施例 3. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシシベンズアルデヒド (5.60 g, 0.0128 mol) のアセトニトリル溶液 (30 ml) に、りん酸二水素ナトリウム (12.0 g, 0.100 mol) 水溶液 (10 ml)、亜塩素酸ナトリウム (5.19 g, 0.0577 mol) 水溶液 (30 ml) および過酸化水素水 (1.701 ml, 30 %) を加えた後、室温で 5 時間攪拌した。反応液を水で希釈した後、酢酸エチルで抽出した。

抽出液は、飽和ハイドロサルファナイトナトリウム ($\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_4$) 水溶液および飽和食塩水で洗浄し、乾燥後、濃縮することにより標題化合物 (5.20 g, 0.0115 mol, 90 %) を得た。

実施例 4. 3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸

3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシベンズアルデヒド (1.87 g, 4.28 mmol) のアセトニトリル溶液 (12 ml) に、りん酸二水素ナトリウム (4.01 g, 33.42 mmol) 水溶液 (7 ml)、亜塩素酸ナトリウム (1.74 g, 19.33 mmol) 水溶液 (7 ml) および過酸化水素水 (1.89 ml, 30%) を加えた後、室温で5時間攪拌した。反応液を水で希釈した後、酢酸エチルで抽出した。抽出液は、飽和ハイドロサルファナイトナトリウム ($\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_4$) 水溶液および飽和食塩水で洗浄し、乾燥後、濃縮することにより標題化合物 (1.90 g, 4.20 mmol, 98 %) を得た。

実施例 5. N-[4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシベンゾイル]ピペリジン

4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸 (173 mg, 0.3827 mmol) の塩化メチレン溶液 (20 ml) に、ピペリジン (56 mg, 0.6576 mmol) および1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (169 mg, 0.8815 mmol) を加え、室温で8時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥後、溶媒留去した。得られた残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 2 : 1) で精製し、標題化合物 (129 mg, 0.2485 mmol, 65 %) を得た。

実施例 6. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシベンゾイル]ピペリジン

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸 (0.95 g, 2.10 mmol) の塩化メチレン溶液 (50 ml) に、ピペリジン (0.358 g, 4.20 mmol) および 1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (1.21 g, 6.30 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 50:1) で精製し、標題化合物 (1.02 g, 2.09 mmol, 99 %) を得た。

実施例7. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシベンゾイル]モルフォリン

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸 (1.17 g, 2.59 mmol) の塩化メチレン溶液 (80 ml) に、モルフォリン (0.451 g, 5.17 mmol) および 1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (1.49 g, 7.76 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 50:1) で精製し、標題化合物 (1.27 g, 2.59 mmol, 99 %) を得た。

実施例8. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸 (0.460 g, 1.02 mmol) の塩化メチレン溶液 (40ml) に、p-メトキシアニリン (0.250 g, 2.03 mmol)、トリエチルアミン (0.206 g, 2.03 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.344 g, 2.03 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した

。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン = 1:2）で精製し、エーテルにて再結晶を行い標題化合物（0.211 g, 0.379 mmol, 37 %）を得た。

実施例9. 4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸

4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸（150 mg, 0.3554 mmol）のエタノール（10 ml）およびジオキサン（10 ml）の混合溶液に、10 % Pd-C（50 mg）を加え、水素気流下に室温で16時間攪拌した。反応液を濾過後、濾液を減圧下濃縮した後、残渣をヘキサンで洗浄することにより標記化合物（97 mg, 0.2679 mmol, 75 %）を得た。

実施例10. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸（159.53 g, 1.156 mmol）をエタノール（20 ml）に溶解し、5% Pd-C（0.250 g）のエタノール懸濁液（3 ml）に加えた後、水素気流下に室温で16時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を濃縮し、得られる残渣をエーテルより再結晶を行い、標題化合物（0.630 g, 1.74 mmol, 79 %）を得た。

実施例11. 3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸

3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸（0.52 g, 1.15 mmol）をエタノール（10 ml）に溶解し、5% Pd-C（0.15 g）のエタノール懸濁液（3 ml）に加えた後、水素気流下に室温で16時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホ

ルム：メタノール = 9:1) で精製し、標題化合物 (0.41 g, 1.13 mmol, 98 %) を得た。

実施例12. 4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-アセトキシ安息香酸

4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸 (97 mg, 0.2679 mmol) を無水酢酸 (20 ml) に溶解し、2 時間加熱還流した。反応液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (5% メタノール-塩化メチレン) で精製することにより、標題化合物 (65 mg, 0.1608 mmol, 60 %) を得た。

実施例13. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-アセトキシ安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸 (1.30g, 3.59 mmol) を無水酢酸 (5 ml) に溶解し、65 °C にて3時間加熱攪拌した。冷後、反応液に水 (20 ml) を加え室温で1時間攪拌した後、酢酸エチルにて抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄後、乾燥し、溶媒を溜去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール = 10:1) で精製し、標題化合物 (0.99 g, 2.45 mmol, 68 %) を得た。

実施例14. 3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-アセトキシ安息香酸

3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸 (0.288 g, 0.795 mmol) を無水酢酸 (5 ml) に溶解し、65 °C にて3時間加熱攪拌した。冷後、反応液に水 (20 ml) を加え室温で1時間攪拌した後、酢酸エチルにて抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄後、乾燥し、溶媒を溜去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール = 9:1) で精製し、標題化合物 (0.245 g, 0.541 mmol, 68 %) を得た。

実験例15. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸メチルエステル

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸 (0.800 g, 2.21 mmol) をメタノール (4 ml)、ベンゼン (28 ml) の混合溶媒に溶解し、トリメチルシリルジアゾメタン (10 % ヘキサン溶液) (0.303 g, 2.65 mmol) を加えた後、室温にて3時間攪拌した。反応液を濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 3:1) で精製し、標題化合物 (0.800 g, 2.13 mmol, 96 %) を得た。

実施例16. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-メトキシ安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-メトキシベンズアルデヒド (0.409 g, 1.14 mmol) のアセトニトリル溶液 (10 ml) に、りん酸二水素ナトリウム (1.06 g, 8.86 mmol) 水溶液 (5 ml)、亜塩素酸ナトリウム (0.460 g, 5.11 mmol) 水溶液 (7 ml) および過酸化水素水 (0.502 ml, 30%) を加えた後、室温で5時間攪拌した。反応液を水で希釈した後、酢酸エチルで抽出した。抽出液は、飽和ヒドロサルファナイトナトリウム ($\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_4$) 水溶液および飽和食塩水で洗浄し、乾燥後、濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 2:1) で精製し、標題化合物 (0.260 g, 0.691 mmol, 61 %) を得た。

実施例17. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-イソプロポキシ安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-イソプロポキシベンズアルデヒド (0.530 g, 1.37 mmol) のアセトニトリル溶液 (5 ml) に、りん酸二水素ナトリウム (1.28 g, 10.65 mmol) 水溶液 (5 ml)、亜塩素酸ナトリウム (0.533g, 6.15 mmol) 水溶液 (7

ml) および過酸化水素水 (0.18 ml, 30%) を加えた後、室温で5時間攪拌した。反応液を水で希釈した後、酢酸エチルで抽出した。抽出液は、飽和ハイドロサルファナイトナトリウム ($\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_4$) 水溶液および飽和食塩水で洗浄し、乾燥後、濃縮することにより標題化合物 (0.475 g, 1.18 mmol, 86 %) を得た。

実施例18. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-フェノキシ安息香酸 メチルエステル

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸メチルエステル (0.510 g, 1.18 mmol) を塩化メチレン (12 ml) に溶解し、酢酸銅 (0.215 g, 1.18 mmol)、フェニルボロン酸 (0.289 g, 2.37 mmol)、モレキュラシーブス 4A (0.300 g)、トリエチルアミン (0.299 g, 2.96 mmol)、ピリジン (0.234 g, 2.96 mmol) を順次加えた後、室温で12時間攪拌した。反応液を濾過した後、濾液を水にあげ塩化メチレンで抽出した。抽出液は、飽和食塩水で洗浄し、乾燥後、濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 3:1) で精製することにより標題化合物 (0.220 g, 0.487mmol, 41 %) を得た。

実施例19. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-メトキシフェノキシ)安息香酸 メチルエステル

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸メチルエステル (0.805 g, 2.14 mmol) を塩化メチレン (50 ml) に溶解し、酢酸銅 (0.429 g, 2.36 mmol)、3-メトキシフェニルボロン酸 (0.651 g, 4.28 mmol)、モレキュラシーブス 4A (0.500 g)、トリエチルアミン (0.541 g, 5.35 mmol)、ピリジン (0.423 g, 5.35 mmol) を順次加えた後、室温で12時間攪拌した。反応液を濾過した後、濾液を水にあげ塩化メチレンで抽出した。抽出液は、飽和食塩水で洗浄し、乾燥後、濃縮した。得られた残渣をシリ

カゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 4:1）で精製することにより標題化合物（0.200 g, 0.414 mmol, 19 %）を得た。

実施例20. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸 メチルエステル

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸メチルエステル（0.194 g, 0.516 mmol）のベンゼン溶液に、3-ピリジンメタノール（0.084 g, 0.774 mmol）、トリn-ブチルホスフィン（0.156 g, 0.774 mmol）およびN,N,N',N'-テトラメチルアゾジカルボキサミド（0.133 g, 0.774 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を2N 水酸化ナトリウム水溶液（15 ml）にあけ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 2:3）で精製し、標題化合物（0.167 g, 0.358 mmol, 69 %）を得た。

実施例21. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジルメチルオキシ)安息香酸 メチルエステル

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸メチルエステル（0.500 g, 1.33 mmol）のベンゼン溶液に、4-ピリジンメタノール（0.232 g, 2.13 mmol）、トリn-ブチルホスフィン（0.430 g, 2.13 mmol）およびN,N,N',N'-テトラメチルアゾジカルボキサミド（0.366 g, 2.13 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を2N 水酸化ナトリウム水溶液（15 ml）にあけ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 2:3）で精製し、標題化合物（0.610 g, 1.31 mmol, 98 %）を得た。

実施例22. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(t-
プトキシカルボニルメチルオキシ)安息香酸 メチルエステル

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸メチルエステル (1.09 g, 2.53 mmol)をアセトン(50 ml)に溶解し、無水炭酸ナトリウム (0.420 g, 3.03 mmol)およびプロモ酢酸-t-ブチル (0.592 g, 3.03 mmol)を加えた後、3時間加熱還流した。反応液を濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 2:1) で精製し、標題化合物 (0.650 g, 1.33 mmol, 53 %) を得た。

実施例23. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-フェ
ノキシ安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-フェノキシ安息香酸 メチルエステル (0.220 g, 0.487 mmol) を1 N NaOH 水溶液 (3 ml) および1,4-ジオキサン (5 ml) の混合液に溶解し、室温で12時間攪拌した。反応液を水で希釈し、濃塩酸で酸性とした後、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 2:1) で精製し、標題化合物 (0.210 g, 0.479 mmol, 98 %) を得た。

実施例24. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-
メトキシフェノキシ)安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-メトキシフェノキシ)安息香酸 メチルエステル (0.200 g, 0.414 mmol) を1 N NaOH 水溶液 (3 ml) および1,4-ジオキサン (3 ml) の混合液に溶解し、室温で6時間攪拌した。反応液を水で希釈し、濃塩酸で酸性とした後、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣をエーテルから再結晶し、標題化合物 (0.190 g, 0

.408 mmol, 99 %) を得た。

実施例25. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸メチルエステル (0.165 g, 0.353 mmol) を 1 N NaOH 水溶液 (3 ml) および1,4-ジオキサン (3 ml) の混合液に溶解し、室温で6時間攪拌した。反応液を水で希釈し、濃塩酸で酸性とした後、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 2:3) で精製し、標題化合物 (0.150 g, 0.331 mmol, 88 %) を得た。

実施例26. 5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジルメチルオキシ)安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジルメチルオキシ)安息香酸メチルエステル (0.600 g, 1.28 mmol) を 1 N NaOH 水溶液 (3 ml) および1,4-ジオキサン (3 ml) の混合液に溶解し、室温で6時間攪拌した。反応液を水で希釈し、濃塩酸で酸性とした後、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 1:2) で精製し、標題化合物 (0.500 g, 1.10 mmol, 86%) を得た。

実施例27. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンゾイル]ピペリジン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシベンゾイル]ピペリジン (1.02 g, 2.09 mmol) をエタノール (50 ml) に溶解し、5% Pd-C (0.200 g) のエタノール懸濁液 (5 ml) に加えた後、水素気流下で室温で16時間攪拌した。反応液を濾

過し、濾液を濃縮して得られた残渣をエーテルにて再結晶を行い、
標題化合物 (0.760 g, 1.95 mmol, 93 %) を得た。

実施例28. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-
ヒドロキシベンゾイル]モルフォリン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジル
オキシベンゾイル]モルフォリン (1.27 g, 2.59 mmol) をエタノール
(50 ml) に溶解し、5% Pd-C (0.200 g) のエタノール懸濁液 (5
ml) に加えた後、水素気流下で室温で16時間攪拌した。反応液を
濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をエーテルにて再結晶を行い、
標題化合物 (1.00 g, 2.49 mmol, 96 %) を得た。

実施例29. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(
3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキ
シベンゾイル]ピペリジン (0.320 g, 0.746 mmol) のベンゼン溶液
(30 ml) に、3-ピリジンメタノール (0.102 g, 0.932 mmol)、トリ
フェニルホスフィン (0.293 g, 1.12 mmol) およびジエチルアゾジ
カルボキシレート (0.195 g, 1.12 mmol) を加え、室温で12時間攪
拌した。反応液を2N 水酸化ナトリウム水溶液 (15 ml) にあけ、塩
化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去し
た。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサ
ン：酢酸エチル= 1.5:8.5) で精製し、標題化合物 (0.350 g, 0.67
3 mmol, 90 %) を得た。

実施例30. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(
4-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキ
シベンゾイル]ピペリジン (0.500 g, 1.17 mmol) のベンゼン溶液(
30 ml) に、4-ピリジンメタノール (0.254 g, 2.33 mmol)、トフェ

ニルホスフィン (0.611 g, 2.33 mmol) およびジエチルアゾジカルボキシレート (0.406 g, 2.33 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を2N 水酸化ナトリウム水溶液 (15 ml) にあけ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 1:5) で精製し、標題化合物 (0.375 g, 0.721 mmol, 62 %) を得た。

実施例31. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンゾイル]ピペリジン (0.150 g, 0.350 mmol) を塩化メチレン (3.5 ml) に溶解し、酢酸銅 (0.064 g, 0.350 mmol)、3-ピリジルボロン酸 (0.114 g, 0.700 mmol)、モレキュラシーブス 4A (0.150 g)、トリエチルアミン (0.088 g, 0.874 mmol)、ピリジン (0.069 g, 0.874 mmol) を順次加えた後、室温で12時間攪拌した。反応液を濾過した後、濾液を水にあけ塩化メチレンで抽出した。抽出液は、飽和食塩水で洗浄し、乾燥後、濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム: メタノール = 9:1) で精製することにより、標題化合物 (0.063 g, 0.125 mmol, 36 %) を得た。

実施例32. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンゾイル]ピペリジン (0.150 g, 0.350 mmol) を塩化メチレン (3.5 ml) に溶解し、酢酸銅 (0.064 g, 0.350 mmol)、4-ピリジルボロン酸 (0.086 g, 0.700 mmol)、モレキュラシーブス 4A (0.150 g)、トリエチルアミン (0.088 g, 0.874 mmol)、ピリジン (0.

069 g, 0.874 mmol) を順次加えた後、室温で12時間攪拌した。反応液を濾過した後、濾液を水にあげ塩化メチレンで抽出した。抽出液は、飽和食塩水で洗浄し、乾燥後、濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 9:1）で精製することにより、標題化合物（0.055 g, 0.109 mmol, 31 %）を得た。

実施例33. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(メトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンゾイル]ピペリジン（0.200 g, 0.465 mmol）をアセトン（30 ml）に溶解し、無水炭酸ナトリウム（0.077 g, 0.558 mmol）およびブromo酢酸メチル（0.078 g, 0.512 mmol）を加えた後、3時間加熱還流した。反応液を濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:1）で精製し、標題化合物（0.230 g, 0.459 mmol, 99 %）を得た。

実施例34. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(t-ブトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンゾイル]ピペリジン（0.200 g, 0.467 mmol）をアセトン（30 ml）に溶解し、無水炭酸ナトリウム（0.078 g, 0.561 mmol）およびブromo酢酸-t-ブチル（0.109 g, 0.561 mmol）を加えた後、3時間加熱還流した。反応液を濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 2:1）で精製し、標題化合物（0.205 g, 0.378 mmol, 81 %）を得た。

実施例35. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシ

シベンゾイル]モルフォリン (0.210 g, 0.487 mmol) のベンゼン溶液に、3-ピリジンメタノール (0.080 g, 0.731 mmol)、トリフェニルホスフィン (0.192 g, 0.731 mmol) およびジエチルアゾジカルボキシレート (0.127 g, 0.731 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を2N 水酸化ナトリウム水溶液 (15 ml) にあけ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 1.5:8.5) で精製し、標題化合物 (0.195 g, 0.374 mmol, 77 %) を得た。

実施例36. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンゾイル]モルフォリン (0.500 g, 1.16 mmol) のベンゼン溶液に、4-ピリジンメタノール (0.253 g, 2.32 mmol)、トリフェニルホスフィン (0.609 g, 2.32 mmol) およびジエチルアゾジカルボキシレート (0.404 g, 2.32 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を2N 水酸化ナトリウム水溶液 (15 ml) にあけ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 1:5) で精製し、標題化合物 (0.380 g, 0.728 mmol, 63 %) を得た。

実施例37. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンゾイル]モルフォリン (0.100 g, 0.232 mmol) を塩化メチレン (2.5 ml) に溶解し、酢酸銅 (0.042 g, 0.232 mmol)、3-ピリジルボロン酸 (0.076 g, 0.464 mmol)、モレキュラシーブス 4A (0

.100 g)、トリエチルアミン (0.059 g, 0.580 mmol)、ピリジン (0.046 g, 0.580 mmol) を順次加えた後、室温で12時間攪拌した。反応液を濾過した後、濾液を水にあげ塩化メチレンで抽出した。抽出液は、飽和食塩水で洗浄し、乾燥後、濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール = 9:1) で精製し、標題化合物 (0.050 g, 0.0984 mmol, 42 %) を得た。

実施例 38. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンゾイル]モルフォリン (0.150 g, 0.348 mmol) を塩化メチレン (3.5 ml) に溶解し、酢酸銅 (0.070 g, 0.383 mmol)、4-ピリジルボロン酸 (0.086 g, 0.696 mmol)、モレキュラシーブス 4A (0.150 g)、トリエチルアミン (0.088 g, 0.870 mmol)、ピリジン (0.069 g, 0.870 mmol) を順次加えた後、室温で12時間攪拌した。反応液を濾過した後、濾液を水にあげ塩化メチレンで抽出した。抽出液は、飽和食塩水で洗浄し、乾燥後、濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール = 9:1) で精製し、標題化合物 (0.052 g, 0.102 mmol, 29 %) を得た。

実施例 39. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(メトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンゾイル]モルフォリン (0.200 g, 0.465 mmol) をアセトン (30 ml) に溶解し、無水炭酸ナトリウム (0.077 g, 0.558 mmol) およびブromo酢酸メチル (0.078 g, 0.512 mmol) を加えた後、3時間加熱還流した。反応液を濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をシリカ

ゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:1）で精製し、標題化合物（0.230 g, 0.398 mmol, 86 %）を得た。

実施例40. N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(t-ブトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ヒドロキシベンゾイル]モルフォリン（0.200 g, 0.465 mmol）をアセトン（30 ml）に溶解し、無水炭酸ナトリウム（0.077 g, 0.558 mmol）およびブromo酢酸-t-ブチル（0.109 g, 0.558 mmol）を加えた後、3時間加熱還流した。反応液を濾過し、濾液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 2:1）で精製し、標題化合物（0.198 g, 0.363 mmol, 78 %）を得た。

実施例41. 4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシ安息香酸

4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸（312 mg, 0.6902 mmol）をアセトニトリル（15 ml）および水（5 ml）の混合溶液に溶解し、室温で硝酸第二セリウムアンモニウム（以下、CANと略称する）（946 mg, 1.7262 mmol）を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒留去した。残渣をエーテルから再結晶し、標題化合物（187 mg, 0.4431 mmol, 64 %）を得た。

実施例42. 6-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシ安息香酸

6-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸（106 mg, 0.2345 mmol）をアセトニトリル（6 ml）および水（2 ml）の混合溶液に溶解し、室温でCAN（321 mg, 0.5857 mmol）を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒留去した。残渣をエー

テルから再結晶し、標題化合物 (62 mg, 0.1469 mmol, 64 %)を得た。

実施例43. 5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシ安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸 (0.490 g, 1.08 mmol) をアセトニトリル (15 ml) および水 (3 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (1.48 g, 2.71 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣をエーテルから再結晶し、標題化合物 (0.217 g, 0.514 mmol, 48 %) を得た。

実施例44. 3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシ安息香酸

3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシ安息香酸 (0.55 g, 1.21 mmol) をアセトニトリル (9 ml) および水 (3 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (1.67 g, 3.03 mmol) を加え、室温で2時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣をエーテルから再結晶し、標題化合物 (0.250 g, 0.592 mmol, 49 %) を得た。

実施例45. 4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸

4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-アセトキシ安息香酸 (60 mg, 0.1485 mmol) をアセトニトリル (15 ml) および水 (5 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (203 mg, 0.3704 mmol) を加え、室温で3時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣を分取用

薄層クロマトグラフィー（5% メタノール-塩化メチレン）で精製し、標題化合物（38 mg, 0.1016 mmol, 68 %）を得た。

実施例46. 5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-アセトキシ安息香酸（0.200 g, 0.495 mmol）をアセトニトリル（9 ml）および水（3 ml）の混合溶液に溶解し、室温でCAN（0.678 g, 1.24 mmol）を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣をエーテルから再結晶し、標題化合物（0.160 g, 0.425 mmol, 86 %）を得た。

実施例47. 3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸

3-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-アセトキシ安息香酸（0.300 g, 0.663 mmol）をアセトニトリル（9 ml）および水（3 ml）の混合溶液に溶解し、室温でCAN（0.909 g, 1.658 mmol）を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣をエーテルから再結晶し、標題化合物（0.248 g, 0.662 mmol, 99 %）を得た。

実施例48. 4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシ安息香酸

4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸（22 mg, 0.059 mmol）をメタノール（2 ml）に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（3 ml）を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残

渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 10:1）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物（12 mg, 0.0361 mmol, 61 %）を得た。

実施例49. 5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシ安息香酸

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸（0.150 g, 0.401 mmol）をメタノール（2 ml）に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（3 ml）を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 10:1）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.055 g, 0.166 mmol, 42 %）を得た。

実施例50. 3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシ安息香酸

3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸（0.036 g, 0.0963 mmol）をメタノール（2 ml）に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（2 ml）を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 9:1）で精製し、ジイソプロピルエーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.010 g, 0.0301 mmol, 31 %）を得た。

実施例51. 5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-メトキシ安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-メトキシ安息香酸（0.257 g, 0.684 mmol）をアセトニトリル（9 ml）および水

(3 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (0.937 g, 1.71 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣をエーテルから再結晶し、標題化合物 (0.237 g, 0.683 mmol, 99 %) を得た。

実施例52. 5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-イソプロポキシ安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-イソプロポキシ安息香酸 (0.472 g, 1.17 mmol) をアセトニトリル (9 ml) および水 (3 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (1.60 g, 2.92 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣をエーテルから再結晶し、標題化合物 (0.364 g, 0.972 mmol, 83 %) を得た。

実施例53. 5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-フェノキシ安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-フェノキシ安息香酸 (0.220 g, 0.502 mmol) をアセトニトリル (12 ml) および水 (4 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (0.688 g, 1.26 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣をエーテルから再結晶し、標題化合物 (0.100 g, 0.245 mmol, 49 %) を得た。

実施例54. 5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-メトキシフェノキシ)安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-メトキシフェノキシ)安息香酸 (0.194 g, 0.408 mmol) をアセトニトリル (9

ml) および水 (3 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN(0.638 g, 1.02mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣をエーテルから再結晶し、標題化合物 (0.159 g, 0.365 mmol, 89 %) を得た。

実施例55. 5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸 (0.100 g, 0.221 mmol) をアセトニトリル (9 ml) および水 (3 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (0.303 g, 0.552 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 1:2) で精製した後、エーテルから再結晶し、標題化合物 (0.071 g, 0.168 mmol, 76 %) を得た。

実施例56. 5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(4-ピリジルメチルオキシ)安息香酸

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジルメチルオキシ)安息香酸 (0.425 g, 0.938 mmol) をアセトニトリル (18 ml) および水 (6 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (1.29 g, 2.35 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 9:1) で精製した後、エーテルから再結晶し、標題化合物 (0.376 g, 0.868mmol, 93 %) を得た。

実施例57. N-[4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル] ピペリジン

N-[4-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-ベンジルオキシベンゾイル]ピペリジン (129 mg, 0.2485 mmol) をアセトニトリル (15 ml) および水 (5 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (341 mg, 0.6222 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒留去した。残査をフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 2 : 1) で精製し、標題化合物 (85 mg, 0.1738 mmol, 70 %) を得た。

実施例 58. N-[4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル] モルフォリン

4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシ安息香酸 (60 mg, 0.1421 mmol) の塩化メチレン溶液 (10 ml) に、モルフォリン (19 mg, 0.2183 mmol) および1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (55 mg, 0.2869 mmol) を加え、室温で16時間攪拌した。反応液を氷水にあけ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥後、溶媒留去した。得られた残査を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 1 : 2) で精製し、標題化合物 (55 mg, 0.1120 mmol, 79 %) を得た。

実施例 59. N-[4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン

4-(5,6-ジメトキシ-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシ安息香酸 (60 mg, 0.1421 mmol) の塩化メチレン溶液 (10 ml) に、p-メトキシアニリン (26 mg, 0.2113 mmol)、トリエチルアミン (29 mg, 0.2871 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (48 mg, 0.2840 mmol) を加え、室温で3時間攪拌した。反応液を氷水にあけ、エーテル抽出した。抽出液を水洗し、乾

燥後、溶媒留去した。得られた残査を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝1：1）で精製し、標題化合物（55 mg, 0.1143 mmol, 73 %）を得た。

実施例60. N-[6-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン

6-(5,6-ジメトキシ-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシ安息香酸（29 mg, 0.0687 mmol）の塩化メチレン溶液（3 ml）に、p-メトキシアニリン（13 mg, 0.1056 mmol）、トリエチルアミン（15 mg, 0.1485 mmol）および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム（24 mg, 0.1420 mmol）を加え、室温で3時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、エーテル抽出した。抽出液を水洗し、乾燥後、溶媒留去した。得られた残査を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝1：1）で精製し、標題化合物（20 mg, 0.0687 mmol, 55 %）を得た。

実施例61. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル] ピペリジン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシ安息香酸（0.050 g, 0.118 mmol）の塩化メチレン溶液（5 ml）に、ピペリジン（0.025 g, 0.296 mmol）および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.068 g, 0.355 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒留去した。得られた残査を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール＝10:1）で精製し、標題化合物（0.025 g, 0.0511 mmol, 43 %）を得た。

実施例62. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル] モルフォリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシ安息香酸 (0.050 g, 0.118 mmol) の塩化メチレン溶液 (5 ml) に、塩化オキザリル (0.150 g, 1.18 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を濃縮して得られた残渣にモルフォリン (0.036 g, 0.414 mmol) の THF 溶液を加え、室温で30分間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 1:1) で精製し、標題化合物 (0.058 g, 0.117 mmol, 99 %) を得た。

実施例63. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシ安息香酸 (0.065 g, 0.154 mmol) の塩化メチレン溶液 (5 ml) に、p-メトキシアニリン (0.038 g, 0.308 mmol)、トリエチルアミン (0.031 g, 0.308 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.052 g, 0.308 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 1:2) で精製し、標題化合物 (0.066 g, 0.125 mmol, 81 %) を得た。

実施例64. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル] ピペリジン

3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシ安息香酸 (0.095 g, 0.23 mmol) の塩化メチレン溶液 (10 ml) に、ピペリジン (0.038 g, 0.45 mmol) および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (0.129 g, 0.68 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあ

け、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:1）で精製し、標題化合物（0.060 g, 0.12 mmol, 55 %）を得た。

実施例65. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル] モルフォリン

3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシ安息香酸（0.080 g, 0.19 mmol）の塩化メチレン溶液（10 ml）に、モルフォリン（0.033 g, 0.38 mmol）および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.109 g, 0.57 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあけ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:1）で精製し、標題化合物（0.057 g, 0.12 mmol, 61 %）を得た。

実施例66. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン

3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ベンジルオキシ安息香酸（0.060 g, 0.14 mmol）の塩化メチレン溶液（5 ml）に、p-メトキシアニリン（0.035 g, 0.28 mmol）、トリエチルアミン（0.029 g, 0.28 mmol）および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム（0.048 g, 0.28 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあけ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:1）で精製し、標題化合物（0.038 g, 0.072 mmol, 51 %）を得た。

実施例67. N-[4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-

イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン

4-(5,6-ジメトキシ-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (11 mg, 0.0294 mmol) の塩化メチレン溶液 (3 ml) に、p-メトキシアニリン (4.3mg, 0.0349 mmol)、トリエチルアミン (5.9 mg, 0.0584 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (9.9 mg, 0.0585 mmol) を加え、室温で6時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、エーテル抽出した。抽出液を水洗し、乾燥後、溶媒留去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 1 : 3) で精製し、標題化合物 (6 mg, 0.0125 mmol, 43 %) を得た。

実施例68. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル] ピペリジン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.040 g, 0.107 mmol) の塩化メチレン溶液 (5 ml) に、ピペリジン (0.027 g, 0.321 mmol) および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (0.062 g, 0.321 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒留去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム: メタノール = 10:1) で精製し、標題化合物 (0.008 g, 0.0181 mmol, 17 %) を得た。

実施例69. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル] モルフォリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.048 g, 0.128 mmol) の塩化メチレン溶液 (5 ml) に、モルフォリン (0.034 g, 0.385 mmol) および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (0.074 g, 0

.385 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 10:1）で精製し、標題化合物（0.017 g, 0.0383 mmol, 30 %）を得た。

実施例70. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸（0.070 g, 0.187 mmol）の塩化メチレン溶液（5 ml）に、p-メトキシアニリン（0.046 g, 0.374 mmol）、トリエチルアミン（0.038 g, 0.374 mmol）および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム（0.063 g, 0.374 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 10:1）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.043 g, 0.0897 mmol, 48 %）を得た。

実施例71. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル] ピペリジン

3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸（0.293 g, 0.783 mmol）の塩化メチレン溶液（30 ml）に、ピペリジン（0.133 g, 1.56 mmol）および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.448 g, 2.34 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 30:1）で精製し、標題化合物（0.152 g, 0.345 mmol, 44 %）を得た。

ol, 44 %) を得た。

実施例72. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル] モルフォリン

3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸(0.380 g, 1.01 mmol) の塩化メチレン溶液(50 ml)に、モルフォリン (0.176 g, 2.02 mmol) および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (0.581 g, 3.03 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール = 30:1) で精製し、標題化合物 (0.175 g, 0.394 mmol, 39 %) を得た。

実施例73. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン

3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸(0.158 g, 0.422 mmol) の塩化メチレン溶液(20 ml)に、p-メトキシアニリン (0.104 g, 0.845 mmol)、トリエチルアミン (0.085 g, 0.845 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.143 g, 0.845 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール = 30:1) で精製し、ジイソプロピルエーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.066 g, 0.138 mmol, 33 %) を得た。

実施例74. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル] ピペリジン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル

ル-2-アセトキシベンゾイル] ピペリジン (0.040 g, 0.0906 mmol) をメタノール (2 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製し、標題化合物 (0.025 g, 0.0626 mmol, 69 %) を得た。

実施例75. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル] モルフォリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル] モルフォリン (0.045 g, 0.101 mmol) をメタノール (2 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製し、標題化合物 (0.020 g, 0.0498 mmol, 49 %) を得た。

実施例76. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン (0.073 g, 0.152 mmol) をメタノール (2ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 1:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.043 g, 0.0983 mmol, 65 %) を得た。

実施例77. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル] ピペリジン

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル] ピペリジン (0.050 g, 0.113 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 9:1) で精製し、標題化合物 (0.017 g, 0.0426 mmol, 38%) を得た。

実施例78. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル] モルフォリン

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル] モルフォリン (0.050 g, 0.113 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 9:1) で精製し、標題化合物 (0.022 g, 0.0542 mmol, 48 %) を得た。

実施例79. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン (0.040 g, 0.0834 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した

後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 30:1）で精製し、標題化合物（0.025 g, 0.0528mmol, 69 %）を得た。

実施例80. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-メトキシベンゾイル] ピペリジン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-メトキシ安息香酸（0.055 g, 0.159 mmol）の塩化メチレン溶液（5 ml）に、ピペリジン（0.027 g, 0.318 mmol）および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.091 g, 0.477 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（酢酸エチル）で精製し、標題化合物（0.0175 g, 0.0423 mmol, 27 %）を得た。

実施例81. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-メトキシベンゾイル] モルフォリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-メトキシ安息香酸（0.050 g, 0.145 mmol）の塩化メチレン溶液（5 ml）に、モルフォリン（0.025 g, 0.289 mmol）および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.083 g, 0.434 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（酢酸エチル）で精製し、標題化合物（0.033 g, 0.0794 mmol, 55 %）を得た。

実施例82. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-メトキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-メトキシ安息香酸 (0.060 g, 0.173 mmol) の塩化メチレン溶液 (5 ml) に、p-メトキシアニリン (0.043 g, 0.347 mmol)、トリエチルアミン (0.035 g, 0.347 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.059 g, 0.347 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (酢酸エチル) で精製し、標題化合物 (0.044 g, 0.0975 mmol, 56 %) を得た。

実施例83. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-イソプロポキシベンゾイル] ピペリジン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-イソプロポキシ安息香酸 (0.066 g, 0.176 mmol) の塩化メチレン溶液 (5 ml) に、ピペリジン (0.030 g, 0.353 mmol) および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (0.101 g, 0.529 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 1:6) で精製し、標題化合物 (0.030 g, 0.068 mmol, 39 %) を得た。

実施例84. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-イソプロポキシベンゾイル] モルフォリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-イソプロポキシ安息香酸 (0.065 g, 0.174 mmol) の塩化メチレン溶液 (5 ml) に、モルフォリン (0.030 g, 0.348 mmol) および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (0.100 g, 0.521 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水

にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:6）で精製し、標題化合物（0.026 g, 0.0586 mmol, 34 %）を得た。

実施例85. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-イソプロポキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-イソプロポキシ安息香酸（0.117 g, 0.313 mmol）の塩化メチレン溶液（10 ml）に、p-メトキシアニリン（0.077 g, 0.626 mmol）、トリエチルアミン（0.063 g, 0.626 mmol）および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム（0.106 g, 0.626 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:2）で精製し、標題化合物（0.095 g, 0.198 mmol, 63 %）を得た。

実施例86. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-フェノキシベンゾイル] ピペリジン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-フェノキシ安息香酸（0.129 g, 0.317 mmol）の塩化メチレン溶液（10 ml）に、ピペリジン（0.054 g, 0.634 mmol）および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.182 g, 0.950 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:1）で精製し、標題化合物（0.060 g, 0.126 mmol, 40 %）を得た。

実施例87. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-

イル)メチル-2-フェノキシベンゾイル] モルフォリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-フェノキシ安息香酸 (0.070 g, 0.172 mmol) の塩化メチレン溶液 (5 ml) に、モルフォリン (0.030 g, 0.343 mmol) および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (0.099 g, 0.515 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製し、標題化合物 (0.040 g, 0.0839 mmol, 49 %) を得た。

実施例88. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-フェノキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-フェノキシ安息香酸 (0.075 g, 0.184 mmol) の塩化メチレン溶液 (5 ml) に、p-メトキシアニリン (0.045 g, 0.368 mmol)、トリエチルアミン (0.037 g, 0.368 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.062 g, 0.368 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 9:1) で精製し、標題化合物 (0.040 g, 0.0780 mmol, 42 %) を得た。

実施例89. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-メトキシフェノキシ)ベンゾイル] ピペリジン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-メトキシフェノキシ)安息香酸 (0.247 g, 0.564 mmol) の塩化メチレン溶液 (5 ml) に、ピペリジン (0.096 g, 1.128 mmol) および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸

塩 (0.324 g, 1.692 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製し、標題化合物 (0.165 g, 0.327 mmol, 58 %) を得た。

実施例90. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-メトキシフェノキシ)ベンゾイル] モルフォリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-メトキシフェノキシ)安息香酸 (0.250 g, 0.613 mmol) の塩化メチレン溶液 (50 ml) に、モルフォリン (0.106 g, 1.225 mmol) および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (0.352 g, 1.838 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製し、標題化合物 (0.173 g, 0.341 mmol, 51 %) を得た。

実施例91. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-メトキシフェノキシ)ベンゾイル]-4-メトキシアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-メトキシフェノキシ)安息香酸 (0.100 g, 0.228 mmol) の塩化メチレン溶液 (10 ml) に、p-メトキシアニリン (0.056 g, 0.457 mmol)、トリエチルアミン (0.046 g, 0.457 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.077 g, 0.457 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 2

:3) で精製し、標題化合物 (0.058 g, 0.107 mmol, 47 %) を得た。

実施例92. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル] ピペリジン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン (0.380 g, 0.731 mmol) をアセトニトリル (12 ml) および水 (4 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (1.00 g, 1.83 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 9:1) で精製し、標題化合物 (0.222 g, 0.453 mmol, 62 %) を得た。

実施例93. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル] モルフォリン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン (0.263 g, 0.506 mmol) をアセトニトリル (12 ml) および水 (4 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (0.693 g, 1.26 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 9:1) で精製し、標題化合物 (0.153 g, 0.311mmol, 61 %) を得た。

実施例94. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-4-メトキシアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-

2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸 (0.135 g, 0.318 mmol) の塩化メチレン溶液 (20 ml) に、p-メトキシアニリン (0.078 g, 0.639 mmol)、トリエチルアミン (0.066 g, 0.639 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.108 g, 0.639 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 9:1) で精製し、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.040 g, 0.0756 mmol, 24 %) を得た。

実施例95. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(4-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル] ピペリジン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン (0.550 g, 1.06 mmol) をアセトニトリル (15 ml) および水 (5 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (1.45 g, 2.64 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 9:1) で精製し、標題化合物 (0.320 g, 0.652 mmol, 62 %) を得た。

実施例96. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(4-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル] モルフォリン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン (0.460 g, 0.885 mmol) をアセトニトリル (15 ml) および水 (5 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (1.21 g, 2.21 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥し

た後、溶媒溜去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 9:1）で精製し、標題化合物（0.270 g, 0.548 mmol, 62 %）を得た。

実施例97. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(4-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-4-メトキシアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(4-ピリジルメチルオキシ)安息香酸（0.135 g, 0.318 mmol）の塩化メチレン溶液（10 ml）に、p-メトキシアニリン（0.078 g, 0.639 mmol）、トリエチルアミン（0.066 g, 0.639 mmol）および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム（0.108 g, 0.639 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 9:1）で精製し、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.054 g, 0.102 mmol, 32 %）を得た。

実施例98. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン（0.050 g, 0.099 mmol）をアセトニトリル（12 ml）および水（4 ml）の混合溶液に溶解し、室温でCAN（0.135 g, 0.247 mmol）を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 9:1）で精製し、標題化合物（0.025 g, 0.0525 mmol, 53 %）を得た。

実施例99. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-

イル)メチル-2-(3-ピリジルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(3-ピリジルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン (0.022 g, 0.0435 mmol) をアセトニトリル (6 ml) および水 (2 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (0.060 g, 0.109 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 9:1) で精製し、標題化合物 (0.012 g, 0.0251 mmol, 58 %) を得た。

実施例100. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(4-ピリジルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン (0.021 g, 0.0415 mmol) をアセトニトリル (6 ml) および水 (2 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (0.057 g, 0.104 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 9:1) で精製し、標題化合物 (0.013 g, 0.580 mmol, 66 %) を得た。

実施例101. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(4-ピリジルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(4-ピリジルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン (0.042 g, 0.0827 mmol) をアセトニトリル (9 ml) および水 (3 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (0.113 g, 0.207 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (

ヘキサン：酢酸エチル：メタノール = 3:6:1) で精製し、標題化合物 (0.025 g, 0.0523 mmol, 63 %) を得た。

実施例102. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(メトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル)]ピペリジン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(メトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン (0.260 g, 0.520 mmol) をアセトニトリル (12 ml) および水 (4 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (0.713 g, 1.30 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 1:3) で精製し、標題化合物 (0.180 g, 0.382 mmol, 73 %) を得た。

実施例103. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(メトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(メトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン (0.240 g, 0.478 mmol) をアセトニトリル (12 ml) および水 (4 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (0.655 g, 1.20 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 1:3) で精製し、標題化合物 (0.180 g, 0.381 mmol, 80 %) を得た。

実施例104. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(t-ブトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル)]ピペリジン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(*t*-ブトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]ピペリジン (0.292 g, 0.538 mmol) をアセトニトリル (12 ml) および水 (4 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (0.737 g, 1.34 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 2:1) で精製し、標題化合物 (0.175 g, 0.341 mmol, 63 %) を得た。

実施例105. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(*t*-ブトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン

N-[5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(*t*-ブトキシカルボニルメチルオキシ)ベンゾイル]モルフォリン (0.290 g, 0.533 mmol) をアセトニトリル (12 ml) および水 (4 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (0.731 g, 1.33 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 2:1) で精製し、標題化合物 (0.170 g, 0.330 mmol, 62 %) を得た。

実施例106. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-3,4,5-トリメトキシアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (20 ml) に、3,4,5-トリメトキシアニリン (0.216 g, 1.18 mmol)、トリエチルアミン (0.119 g, 1.18 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.199 g, 1.18 mmol) を加え、室

温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 10:1）で精製し、標題化合物（0.109 g, 0.202 mmol, 38 %）を得た。

実施例107. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-3,4-ジメトキシアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸（0.200 g, 0.535 mmol）の塩化メチレン溶液（20 ml）に、3,4-ジメトキシアニリン（0.246 g, 1.604 mmol）、トリエチルアミン（0.162 g, 1.604 mmol）および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム（0.271 g, 1.604 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:2）で精製し、標題化合物（0.110 g, 0.216 mmol, 40 %）を得た。

実施例108. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-アセチルアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸（0.200 g, 0.535 mmol）の塩化メチレン溶液（20 ml）に、4-アセチルアニリン（0.159 g, 1.18 mmol）、トリエチルアミン（0.119 g, 1.18 mmol）および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム（0.199 g, 1.18 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 1:2）で精製し、標題化合物（0.160 g, 0.326 mmol, 61 %）を得た。

実施例109. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-

イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-クロロアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (20 ml) に、4-クロロアニリン (0.150 g, 1.18 mmol)、トリエチルアミン (0.119 g, 1.18 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.199 g, 1.18 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 1:2) で精製し、標題化合物 (0.115 g, 0.238 mmol, 44 %) を得た。

実施例110. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-モルフォリノアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (20 ml) に、4-モルフォリノアニリン (0.286 g, 1.60 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.60 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.60 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 1:2) で精製した後、エーテルにより再結晶を行い、標題化合物 (0.077 g, 0.144 mmol, 27 %) を得た。

実施例111. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-シアノアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (20 ml) に、4-シアノアニリン (0.189 g, 1.60 mmol)、トリエ

チルアミン (0.162 g, 1.60 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.60 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 1:2) で精製を行い、標題化合物 (0.141 g, 0.297 mmol, 56 %) を得た。

実施例112. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (20 ml) に、4-トリフルオロメチルアニリン (0.258 g, 1.60 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.60 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.60 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 1:2) で精製し、標題化合物 (0.123 g, 0.238 mmol, 44 %) を得た。

実施例113. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-3,5-ビストリフルオロメチルアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (20 ml) に、3,5-ビストリフルオロメチルアニリン (0.368 g, 1.604 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレ

ンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:2）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.196 g, 0.335 mmol, 63 %）を得た。

実施例114. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-3,4,5-トリメトキシアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-3,4,5-トリメトキシアニリン (0.100 g, 0.185 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:2）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.050 g, 0.101 mmol, 55 %) を得た。

実施例115. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-3,4-ジメトキシアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-3,4-ジメトキシアニリン (0.100 g, 0.196 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:2）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.032 g, 0.0685 mmol, 35 %) を得た。

実施例116. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-

イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-アセチルアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-アセチルアニリン (0.100 g, 0.204 mmol) をメタノール (6ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 1:2) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.060 g, 0.133 mmol, 65 %) を得た。

実施例117. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-クロロアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-クロロアニリン (0.072 g, 0.149 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 1:2) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.046 g, 0.104 mmol, 70 %) を得た。

実施例118. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-モルフォリノアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-モルフォリノアニリン (0.060 g, 0.110 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー

(ヘキサン：酢酸エチル = 1:2) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.037 g, 0.0752 mmol, 68 %) を得た。

実施例119. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-シアノアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-シアノアニリン (0.100 g, 0.211 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 1:2) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.063 g, 0.146 mmol, 69 %) を得た。

実施例120. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン (0.087 g, 0.168 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 1:2) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.056 g, 0.118 mmol, 70 %) を得た。

実施例121. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-3,5-ビストリフルオロメチルアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-3,5-ビストリフルオロメチルアニリン (0.130 g, 0.222 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 1:2) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.050 g, 0.0921 mmol, 41 %) を得た。

実施例122. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-(S)-1-フェニルエチルアミン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (30 ml) に、(S)-フェネチルアミン (0.130 g, 1.07 mmol)、ジメチルアミノピリジン (0.013 g, 0.107 mmol) および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (0.308 g, 1.60 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 2:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.135 g, 0.283 mmol, 53 %) を得た。

実施例123. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-(R)-1-フェニルエチルアミン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.250 g, 0.668 mmol) の塩化メチレン溶

液(30 ml)に、(R)-フェネチルアミン (0.162 g, 1.337 mmol)、ジメチルアミノピリジン (0.016 g, 0.134 mmol) および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (0.384 g, 2.005 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 2:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.167 g, 0.350 mmol, 52 %) を得た。

実施例124. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-フェノキシベンゾイル]-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-フェノキシ安息香酸 (0.075 g, 0.183 mmol) の塩化メチレン溶液(10 ml)に、1,2,3,4-テトラヒドロキノリン (0.049 g, 0.367 mmol) および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (0.105 g, 0.550 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム: メタノール = 9:1) で精製し、標題化合物 (0.050 g, 0.0955 mmol, 52 %) を得た。

実施例125. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-フェノキシベンゾイル]-2-メチルピペリジン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-フェノキシ安息香酸 (0.080 g, 0.196 mmol) の塩化メチレン溶液(5 ml)に、2-メチルピペリジン (0.039 g, 0.391 mmol) および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩 (0.112 g, 0.587 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷

水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 9:1）で精製し、標題化合物（0.045 g, 0.0919 mmol, 47 %）を得た。

実施例126. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸（0.200 g, 0.473 mmol）の塩化メチレン溶液（20 ml）に、1,2,3,4-テトラヒドロキノリン（0.126 g, 0.946 mmol）および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.272 g, 1.42 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 9:1）で精製し、標題化合物（0.100 g, 0.186 mmol, 39 %）を得た。

実施例127. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-4-メチルピペリジン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸（0.200 g, 0.473 mmol）の塩化メチレン溶液（20 ml）に、4-メチルピペリジン（0.094 g, 0.946 mmol）および1-エチル-3-(3-ジエチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（0.272 g, 1.42 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 9:1）で精製し、標題化合

物 (0.100 g, 0.198 mmol, 42 %) を得た。

実施例128. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-3,4,5-トリメトキシアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸 (0.200 g, 0.473 mmol) の塩化メチレン溶液 (20 ml) に、3,4,5-トリメトキシアニリン (0.260 g, 1.42 mmol)、トリエチルアミン (0.144 g, 1.42 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.240 g, 1.42 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール = 10:1) で精製し、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.050 g, 0.085 mmol, 18 %) を得た。

実施例129. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-4-アセチルアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸 (0.200 g, 0.473 mmol) の塩化メチレン溶液 (20 ml) に、4-アセチルアニリン (0.128 g, 0.946 mmol)、トリエチルアミン (0.096 g, 0.946 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.160 g, 0.946 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール = 10:1) で精製し、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.080 g, 0.148 mmol, 31 %) を得た。

実施例130. 5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(t-ブトキシカルボニルメチルオキシ)安息香酸 メチルエステル

5-(3,4,5,6-テトラメトキシ-2-メチルベンジル)-2-(t-ブトキシカルボニルメチルオキシ)安息香酸 メチルエステル (1.25 g, 2.56 mmol) をアセトニトリル (30 ml) および水 (10 ml) の混合溶液に溶解し、室温でCAN (3.50 g, 6.39 mmol) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 2:1) で精製し、標題化合物 (0.800 g, 1.74 mmol, 68 %) を得た。

実施例131. N-(6-クロロピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

窒素雰囲気下、4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (45 mg, 0.120 mmol) の塩化メチレン (3 ml) 溶液に、塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (61 mg, 0.361 mmol)、5-アミノ-2-クロロピリジン (46 mg, 0.361 mmol)、トリエチルアミン (36 mg, 0.361 mmol) を加えて終夜攪拌した。反応液をクロロホルムで希釈し、水洗、乾燥した後、溶媒を溜去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 3 : 1) で精製し、標題化合物 (10 mg, 0.021 mmol, 17 %) を得た。

実施例132. N-(2-クロロピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

窒素雰囲気下、4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-

2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (98 mg, 0.120 mmol)の塩化メチレン(10 ml)溶液に、塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (89 mg, 0.524 mmol)、3-アミノ-2-クロロピリジン(51 mg, 0.390 mmol)、トリエチルアミン(53 mg, 0.524 mmol)を加えて終夜攪拌した。反応液をクロロホルムで希釈し、水洗、乾燥した後、溶媒を留去した。残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル= 3 : 1) で精製し、標題化合物 (29 mg, 0.060 mmol, 23 %)を得た。

実施例133. N-(2-クロロピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(2-クロロピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド(20 mg, 0.0412 mmol)のメタノール(2 ml)溶液に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (1 ml)を加えて1時間攪拌した。酢酸エチルで抽出して、水洗、乾燥した後、溶媒を留去した。残査を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して、標題化合物 (18 mg, 0.0406 mmol, 99 %)を得た。

実施例134. N-(6-メトキシピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

窒素雰囲気下、4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (137 mg, 0.366 mmol)の塩化メチレン(5 ml)溶液に、塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム(93 mg, 0.555 mmol)、5-アミノ-2-メトキシピリジン(55 mg, 0.440 mmol)、トリエチルアミン(44 mg, 0.440 mmol)を加えて終夜攪拌した。反応液をクロロホルムで希釈し、水洗、乾燥した後

、溶媒を留去した。残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝3：1）で精製し、標題化合物（31 mg, 0.065 mmol, 18 %）を得た。

実施例135. N-(6-メトキシピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(6-メトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド(48 mg, 0.100 mmol)のメタノール(8 ml)溶液に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液(4 ml)を加えて1時間攪拌した。酢酸エチルで抽出して、水洗、乾燥した後、溶媒を留去した。残査を酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル混合溶媒から再結晶して、標題化合物(29 mg, 0.066 mmol, 66 %)を得た。

実施例136. N-[4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-(トリフルオロメチルスルホニル)アニリン

窒素雰囲気下、4-[(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル]-2-アセトキシ安息香酸(240 mg, 0.64 mmol)の塩化メチレン(8 ml)溶液に、塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム(130 mg, 0.77 mmol)、4-(トリフルオロメチルスルホニル)アニリン(173 mg, 0.77 mmol)、トリエチルアミン(78 mg, 0.77 mmol)を加えて2時間攪拌した。反応液をクロロホルムで希釈し、水洗、乾燥した後、溶媒を留去した。残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン：メタノール＝60：1）で精製し、標題化合物(146 mg, 0.251 mmol, 39 %)を得た。

実施例137. N-[4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-(トリフルオロメチルス

ルホニル)アニリン

N-[4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-(トリフルオロメチルスルホニル)アニリン(114 mg, 0.196 mmol)のメタノール(15 ml)溶液に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液(7 ml)を加えて1時間攪拌した。酢酸エチルで抽出して、水洗、乾燥した後、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=4:1)で精製し、標題化合物(35 mg, 0.065 mmol, 33%)を得た。

実施例138. N-(ピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

窒素雰囲気下、4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸(57 mg, 0.152 mmol)の塩化メチレン(5 ml)溶液に、塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム(39 mg, 0.23 mmol)、3-アミノピリジン(21 mg, 0.23 mmol)、トリエチルアミン(23 mg, 0.23 mmol)を加えて終夜攪拌した。反応液をクロロホルムで希釈し、水洗、乾燥した後、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ベンゼン:アセトン=3:1)で精製し、標題化合物(12 mg, 0.027 mmol, 18%)を得た。

実施例139. N-(ピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(ピリジン-3-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド(55 mg, 0.122 mmol)のメタノール(10 ml)溶液に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液(4 ml)を加えて1時間攪拌した。酢酸エチルで抽出して、水洗、乾燥した後、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ベンゼン:アセトン=3:1)で精製し、標題化合物(28

mg, 0.0686 mmol, 56 %)を得た。

実施例140. N-(ピリジン-4-イル)-4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

窒素雰囲気下、4-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (64 mg, 0.171 mmol) の塩化メチレン (5 ml) 溶液に、塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (43 mg, 0.257 mmol)、4-アミノピリジン (24 mg, 0.257 mmol)、トリエチルアミン (26 mg, 0.257 mmol) を加えて終夜攪拌した。反応液をクロロホルムで希釈し、水洗、乾燥した後、溶媒を留去した。続いて、得られた残渣のメタノール (4 ml) 溶液に、飽和重曹水 (10 ml) を加えて1時間攪拌した。酢酸エチルで抽出して、水洗、乾燥した後、溶媒を留去した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン: メタノール = 30: 1) で精製し、標題化合物 (5 mg, 0.012 mmol, 7.2 %) を得た。

実施例141. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-フルオロアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (50 ml) に、4-フルオロアニリン (0.178 g, 1.604 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 1:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.125 g, 0.268 mmol, 50 %) を得た。

実施例142. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-

イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-フルオロアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-フルオロアニリン (0.068 g, 0.145 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 1:2) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.030 g, 0.0705 mmol, 48 %) を得た。

実施例143. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-3-ニトロアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (50 ml) に、3-ニトロアニリン (0.222 g, 1.604 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 1:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.149 g, 0.301 mmol, 56 %) を得た。

実施例144. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-3-ニトロアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-3-ニトロアニリン (0.070 g, 0.142 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水

で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をエーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.060 g, 0.133 mmol, 94 %) を得た。

実施例145. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-2-トリフルオロメチルアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.374 g, 1.000 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、2-トリフルオロメチルアニリン (0.483 g, 3.000 mmol)、トリエチルアミン (0.304 g, 3.000 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.507 g, 3.000 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール = 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.259 g, 0.500 mmol, 50 %) を得た。

実施例146. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-2-トリフルオロメチルアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-2-トリフルオロメチルアニリン (0.100 g, 0.193 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール = 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.090 g, 0.189 mmol, 98 %) を得た。

を得た。

実施例147. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸 エチルエステル

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (50 ml) に、4-アミノ安息香酸 エチルエステル (0.265 g, 1.604 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 1:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.165 g, 0.316 mmol, 59 %) を得た。

実施例148. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸 エチルエステル

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸 エチルエステル (0.060 g, 0.115 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール = 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.040 g, 0.0834 mmol, 73 %) を得た。

実施例149. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-

イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-シアノメチルアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (50 ml) に、4-シアノメチルアニリン (0.212 g, 1.604 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル = 1:1) で精製した後、エーテル:ヘキサン=3:1 にて再結晶を行い、標題化合物 (0.110 g, 0.225 mmol, 42 %) を得た。

実施例150. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-シアノメチルアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-シアノメチルアニリン (0.060 g, 0.123 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール = 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.040 g, 0.0897 mmol, 73 %) を得た。

実施例151. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-3-トリフルオロメチルアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.374 g, 1.000 mmol) の塩化メチレン溶

液(100 ml)に、3-トリフルオロメチルアニリン (0.483 g, 3.000 mmol)、トリエチルアミン (0.304 g, 3.000 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.507 g, 3.000 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.235 g, 0.454 mmol, 45 %) を得た。

実施例152. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-3-トリフルオロメチルアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-3-トリフルオロメチルアニリン (0.100 g, 0.193 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.088 g, 0.185 mmol, 96 %) を得た。

実施例153. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-2-ニトロアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (50 ml) に、2-ニトロアニリン (0.222 g, 1.604 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で12

時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:1）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.140 g, 0.283 mmol, 53 %）を得た。

実施例154. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-2-ニトロアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-2-ニトロアニリン（0.070 g, 0.142 mmol）をメタノール（6 ml）に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（3 ml）を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をエーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.063 g, 0.139 mmol, 98 %）を得た。

実施例155. N-(ピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸（0.374 g, 1.000 mmol）の塩化メチレン溶液（50 ml）に、2-アミノピリジン（0.282 g, 3.000 mmol）、トリエチルアミン（0.304 g, 3.000 mmol）および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム（0.507 g, 3.000 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:1）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.140 g, 0.311 mmol, 31 %）を得た。

実施例156. N-(ピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,

4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(ピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (0.050 g, 0.111 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をエーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.023 g, 0.0564 mmol, 51 %) を得た。

実施例157. N-(ピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.374 g, 1.000 mmol) の塩化メチレン溶液 (50 ml) に、4-アミノピリジン (0.282 g, 3.000 mmol)、トリエチルアミン (0.304 g, 3.000 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.507 g, 3.000 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.050 g, 0.123 mmol, 12 %) を得た。

実施例158. N-(ピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (50 ml) に、3-アミノピリジン (0.151 g, 1.604 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で12

時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 10:1）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.065 g, 0.159 mmol, 30 %）を得た。

実施例159. N-シクロプロピル-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸（0.200 g, 0.535 mmol）の塩化メチレン溶液（50 ml）に、シクロプロピルアミン（0.0916 g, 1.604 mmol）、トリエチルアミン（0.162 g, 1.604 mmol）および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム（0.271 g, 1.604 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:1）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.089 g, 0.215 mmol, 40 %）を得た。

実施例160. N-シクロプロピル-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-シクロプロピル-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド（0.050 g, 0.121 mmol）をメタノール（3 ml）に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（1.5 ml）を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:1）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.023 g, 0.0673 mmol, 56 %）を得た。

実施例161. N-シクロヘキシル-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (50 ml) に、シクロヘキシルアミン (0.159 g, 1.604 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン：酢酸エチル = 1:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.134 g, 0.294 mmol, 55 %) を得た。

実施例162. N-シクロヘキシル-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-シクロヘキシル-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (0.070 g, 0.154 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (1.5 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をエーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.035 g, 0.0846 mmol, 55 %) を得た。

実施例163. N-メチル-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (50 ml) に、N-メチル-4-メトキシアニリン (0.220 g, 1.604 mmol)

1)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 1:2) で精製し標題化合物 (0.142 g, 0.288 mmol, 54 %) を得た。

実施例164. N-メチル-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン

N-メチル-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-メトキシアニリン (0.070 g, 0.142 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (2 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (ヘキサン : 酢酸エチル = 1:2) で精製し標題化合物 (0.050 g, 0.111 mmol, 78 %) を得た。

実施例165. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン

3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (50 ml) に、4-トリフルオロメチルアニリン (0.159 g, 1.604 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残

渣を分取用薄層クロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 1:1）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.140 g, 0.271 mmol, 51 %）を得た。

実施例166. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン（0.150 g, 0.290 mmol）をメタノール（3 ml）に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（2 ml）を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をエーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.080 g, 0.168 mmol, 58 %）を得た。

実施例167. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-4-アミノ安息香酸 エチルエステル

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸（0.2115 g, 0.500 mmol）の塩化メチレン溶液（100 ml）に、4-アミノ安息香酸 エチルエステル（0.248 g, 1.500 mmol）、トリエチルアミン（0.152 g, 1.500 mmol）および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム（0.254 g, 1.500 mmol）を加え、室温で10時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 10:1）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.020 g, 0.0351 mmol, 7 %）を得た。

実施例168. N-(ピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,

4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベン
ズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ安息香酸 (0.2115 g, 0.500 mmol) の塩化メチレン溶液(100 ml)に、4-アミノピリジン (0.141 g, 1.500 mmol)、トリエチルアミン (0.152 g, 1.500 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.254 g, 1.500 mmol) を加え、室温で10時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール= 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.023 g, 0.0460 mmol, 9 %) を得た。

実施例169. N-(ピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベン
ズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ安息香酸 (0.2115 g, 0.500 mmol) の塩化メチレン溶液(100 ml)に、3-アミノピリジン (0.141 g, 1.500 mmol)、トリエチルアミン (0.152 g, 1.500 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.254 g, 1.500 mmol) を加え、室温で10時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール= 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.024 g, 0.0480 mmol, 10 %) を得た。

実施例170. N-シクロプロピル-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンズ

アミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸 (0.2115 g, 0.500 mmol) の塩化メチレン溶液(100 ml)に、シクロプロピルアミン (0.0857 g, 1.500 mmol)、トリエチルアミン (0.152 g, 1.500 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.254 g, 1.500 mmol) を加え、室温で13時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール= 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.029 g, 0.0627 mmol, 13 %) を得た。

実施例171. N-シクロヘキシル-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸 (0.215 g, 0.500 mmol) の塩化メチレン溶液(100 ml)に、シクロヘキシルアミン (0.149 g, 1.500 mmol)、トリエチルアミン (0.152 g, 1.500 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.254 g, 1.500 mmol) を加え、室温で10時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール= 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.032 g, 0.0634 mmol, 13 %) を得た。

実施例172. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)ベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-(3-ピリジルメチルオキシ)安息香酸 (0.215 g, 0.500 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、4-トリフルオロメチルアニリン (0.242 g, 1.500 mmol)、トリエチルアミン (0.152 g, 1.500 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.254 g, 1.500 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.035 g, 0.0618 mmol, 12 %) を得た。

実施例173. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-(トリフルオロメチルスルホニル)アニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.250 g, 0.668 mmol) の塩化メチレン溶液 (70 ml) に、4-(トリフルオロメチルスルホニル)アニリン (0.452 g, 2.005 mmol)、トリエチルアミン (0.203 g, 2.005 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.339 g, 2.005 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.140 g, 0.241 mmol, 36 %) を得た。

実施例174. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-(トリフルオロメチルスルホニル)アニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル

ル-2-アセトキシベンゾイル]-4-(トリフルオロメチルスルホニル)アニリン (0.060 g, 0.103 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (2 ml) を加えた後、室温で2時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.021 g, 0.0389 mmol, 38 %) を得た。

実施例175. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-(トリフルオロメチルスルホニル)アニリン

3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (50 ml) に、4-(トリフルオロメチルスルホニル)アニリン (0.361 g, 1.604 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.084 g, 0.144 mmol, 27 %) を得た。

実施例176. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-2,4-ジクロロアニリン

3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.295 g, 0.789 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、2,4-ジクロロアニリン (0.383 g, 2.366 mmol)、トリエチルアミン (0.239 g, 2.366 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-

ジメチルイミダゾリニウム (0.400 g, 2.366 mmol) を加え、室温で10時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.150 g, 0.289 mmol, 37 %) を得た。

実施例177. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-2,4-ジクロロアニリン

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-2,4-ジクロロアニリン (0.075 g, 0.145 mmol) をメタノール (2 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (1.5 ml) を加えた後、室温で2時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.035 g, 0.0735 mmol, 51 %) を得た。

実施例178. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-モルホリノアニリン

3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.150 g, 0.401 mmol) の塩化メチレン溶液 (40 ml) に、4-モルホリノアニリン (0.214 g, 1.203 mmol)、トリエチルアミン (0.122 g, 1.203 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.203 g, 1.203 mmol) を加え、室温で10時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (酢酸エチル) で精製した後、エーテ

ルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.109 g, 0.203 mmol, 51 %) を得た。

実施例179. N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-モルホリノアニリン

N-[3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-モルホリノアニリン (0.075 g, 0.145 mmol) をメタノール (5 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (1.5 ml) を加えた後、室温で1.5時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (酢酸エチル) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.048 g, 0.0975 mmol, 74 %) を得た。

実施例180. N-(6-メトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、5-アミノ-2-メトキシピリジン (0.199 g, 1.604 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で10時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (酢酸エチル) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.109 g, 0.227 mmol, 42 %) を得た。

実施例181. N-(6-メトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズア

ミド

N-(6-メトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (0.065 g, 0.135 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (1.5 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (酢酸エチル) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.050 g, 0.114 mmol, 84 %) を得た。

実施例182. N-(2,6-ジメトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、3-アミノ-2,6-ジメトキシピリジン塩酸塩 (0.306 g, 1.604 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で10時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール=10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.160 g, 0.313 mmol, 59 %) を得た。

実施例183. N-(2,6-ジメトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(2,6-ジメトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (

0.100 g, 0.196 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (1.5 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール=10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.079 g, 0.169 mmol, 87 %) を得た。

実施例184. N-(6-クロロピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、5-アミノ-2-クロロピリジン (0.206 g, 1.604 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で10時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール=10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.142 g, 0.293 mmol, 55 %) を得た。

実施例185. N-(6-クロロピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(6-クロロピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (0.070 g, 0.144 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (1.5 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反

応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール=10:1）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.056 g, 0.126 mmol, 88 %）を得た。

実施例186. N-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸（0.200 g, 0.535 mmol）の塩化メチレン溶液（100 ml）に、3-アミノ-2-クロロピリジン（0.206 g, 1.604 mmol）、トリエチルアミン（0.162 g, 1.604 mmol）および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム（0.271 g, 1.604 mmol）を加え、室温で10時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン=1:1）で精製し、標題化合物（0.140 g, 0.289 mmol, 54 %）を得た。

実施例187. N-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド（0.070 g, 0.144 mmol）をメタノール（3 ml）に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（1.5 ml）を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン=1:1）で精製した後、エーテルにて

再結晶を行い、標題化合物 (0.040 g, 0.0903 mmol, 63 %) を得た。

実施例188. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸 t-ブチルエステル

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.400 g, 1.070 mmol) の塩化メチレン溶液 (150 ml) に、4-アミノ安息香酸 t-ブチルエステル (0.620 g, 6.209 mmol)、トリエチルアミン (0.325 g, 3.209 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.542 g, 3.209 mmol) を加え、室温で6時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (酢酸エチル:ヘキサン=1:2→1:0) で精製し、標題化合物 (0.302 g, 0.549 mmol, 57 %) を得た。

実施例189. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸 t-ブチルエステル (0.250 g, 0.455 mmol) に、ギ酸 (3.0 ml) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を濃縮して得られた残渣をメタノールにて再結晶を行い、標題化合物 (0.129 g, 0.261 mmol, 57 %) を得た。

実施例190. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸 (0.070 g, 0.142 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水

溶液 (1.5 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、2 N 塩酸水で希釈し、水層を酸性 (pH=1~2) とした後、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム: メタノール=10:1) で精製した後、メタノールにて再結晶を行い、標題化合物 (0.049 g, 0.109 mmol, 77 %) を得た。

実施例191. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-ニトロアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.374 g, 1.000 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、4-ニトロアニリン (0.414 g, 3.000 mmol)、トリエチルアミン (0.304 g, 3.000 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.507 g, 3.000 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (1.5 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム: メタノール=10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.080 g, 0.177 mmol, 18 %) を得た。

実施例192. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメトキシアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、2,6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルアニリン (0.3

95 g, 1.604 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で10時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (酢酸エチル:ヘキサン=1:2) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.099 g, 0.177 mmol, 33 %) を得た。

実施例193. N-(3-t-ブトキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、2-アミノニコチン酸 t-ブチルエステル (0.311 g, 1.604 mmol)、トリエチルアミン (0.162 g, 1.604 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.271 g, 1.604 mmol) を加え、室温で10時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール=15:1) で精製し、標題化合物 (0.157 g, 0.285 mmol, 53 %) を得た。

実施例194. N-(3-ヒドロキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

N-(3-t-ブトキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (0.140 g, 0.254 mmol) に、ギ酸 (2.0 ml) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を濃縮して得られた残渣をシリカゲル

クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 10:1）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.110 g, 0.222 mmol, 87 %）を得た。

実施例195. N-(3-ヒドロキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(3-ヒドロキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド（0.080 g, 0.162 mmol）をメタノール（6 ml）に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液（2 ml）を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、2N 塩酸水で希釈し、水層を酸性（pH=3～4）とした後、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をエーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.051 g, 0.113 mmol, 70 %）を得た。

実施例196. N-(5-t-ブトキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸（0.300 g, 0.802 mmol）の塩化メチレン溶液（100 ml）に、6-アミノニコチン酸 t-ブチルエステル（0.467 g, 2.406 mmol）、トリエチルアミン（0.244 g, 2.406 mmol）および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム（0.407 g, 2.406 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール=10:1）で精製し、標題化合物（0.240 g, 0.436 mmol, 54 %）を得た。

実施例197. N-(5-ヒドロキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

N-(5-t-ブトキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (0.170 g, 0.309 mmol) に、ギ酸 (3.0 ml) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.109 g, 0.220 mmol, 71 %) を得た。

実施例198. N-(5-ヒドロキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(5-ヒドロキシカルボニルピリジン-2-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (0.085 g, 0.172 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (2 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、2N 塩酸水で希釈し、水層を酸性 (ph=3~4) とした後、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をエーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.062 g, 0.137 mmol, 79 %) を得た。

実施例199. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-t-ブトキシカルボニルアミノアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.250 g, 0.668 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、N-(t-ブトキシカルボニル)-p-フェニレンジアミン

(0.209 g, 1.002 mmol)、トリエチルアミン (0.101 g, 1.002 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.279 g, 1.002 mmol) を加え、室温で6時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール=10:1) で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.180 g, 0.319 mmol, 48 %) を得た。

実施例200. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-t-ブトキシカルボニルアミノアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-t-ブトキシカルボニルアミノアニリン (0.140 g, 0.248 mmol) をメタノール (6 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (2 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール=10:1) で精製した後、エーテル：ヘキサン混合溶媒 (3:1) にて再結晶を行い、標題化合物 (0.095 g, 0.182 mmol, 73 %) を得た。

実施例201. N-(ピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (1.120 g, 2.995 mmol) の塩化メチレン溶液 (200 ml) に、3-アミノピリジン (0.424 g, 4.492 mmol)、トリエチルアミン (0.440 g, 4.342 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.735 g, 4.342 mmol) を加え、室温で6時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出

液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 10:1）で精製を行い、標題化合物（0.710 g, 1.576 mmol, 53 %）を得た。

実施例 202. N-(ピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド（メタンスルホン酸塩）

N-(ピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド（0.0327 g, 0.0726 mmol）のメタノール溶液（2 ml）に、メタンスルホン酸（0.00732 g, 0.0762 mmol）を加え、溶媒を溜去して得られた残渣をメタノール：ヘキサン：トルエン混合溶媒（1:2:0.2）にて再結晶を行い、標題化合物（0.030 g, 0.0595 mmol, 82 %）を得た。

実施例 203. N-(ピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド（メタンスルホン酸塩）

N-(ピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド（0.0370 g, 0.0906 mmol）のメタノール：ジクロロメタン混合溶液（1:1, 2 ml）に、メタンスルホン酸（0.00914 g, 0.0951 mmol）を加え、溶媒を溜去した。得られた残渣をメタノール：エーテル：酢酸エチル混合溶媒（2:1:0.5）にて再結晶を行い、標題化合物（0.019 g, 0.0377 mmol, 42 %）を得た。

実施例 204. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-p-フェニレンジアミン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-t-ブトキシカルボニルアミノアニリン（0.205 g, 0.309 mmol）の塩化メチレン溶液（10 ml）に、ト

リフルオロ酢酸 (0.5 ml) を加え、室温で10時間攪拌した。反応液を濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール =95:5) で精製を行い、標題化合物 (0.150 g, 0.355 mmol, 91 %) を得た。

実施例 205. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-p-フェニレンジアミン (塩酸塩)

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-p-フェニレンジアミン (0.0724 g, 0.171 mmol) の塩化メチレン溶液 (3 ml) に、4N 塩酸-ジオキサン溶液 (0.045 g, 0.180 mmol) を加え、溶媒を溜去した。得られた残渣をメタノール:エーテル混合溶媒 (1:10) にて再結晶を行い、標題化合物 (0.070 g, 0.153 mmol, 89 %) を得た。

実施例 206. N-(ピリジン-3-イル)-3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、3-アミノピリジン (0.076 g, 0.802 mmol)、トリエチルアミン (0.081 g, 0.802 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.136 g, 0.802 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール=10:1) で精製を行い、標題化合物 (0.100 g, 0.222 mmol, 41 %) を得た。

実施例 207. N-(ピリジン-3-イル)-3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(ピリジン-3-イル)-3-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾ

キノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (0.060 g, 0.133 mmol) をメタノール (2 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (1.5 ml) を加えた後、室温で2時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (酢酸エチル:ヘキサン = 4:1) で精製した後、メタノールにて再結晶を行い、標題化合物 (0.035 g, 0.0857 mmol, 64 %) を得た。

実施例208. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-(イミダゾール-1-イル)アニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.250 g, 0.668 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、4-(1H-イミダゾール-1-イル)アニリン (0.159 g, 1.003 mmol)、トリエチルアミン (0.101 g, 1.003 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.170 g, 1.003 mmol) を加え、室温で3時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール = 10:1) で精製を行った後、酢酸エチル:ヘキサン混合溶媒 (2:1) にて再結晶を行い、標題化合物 (0.140 g, 0.272 mmol, 41 %) を得た。

実施例209. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-(イミダゾール-1-イル)アニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-(イミダゾール-1-イル)アニリン (0.070 g, 0.136 mmol) をメタノール (5 ml) に溶解し、飽和炭酸

水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をエーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.063 g, 0.133 mmol, 98 %) を得た。

実施例210. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-(1H-ピラゾール-3-イル)アニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.250 g, 0.668 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、4-(1H-ピラゾール-3-イル)アニリン (0.159 g, 1.003 mmol)、トリエチルアミン (0.101 g, 1.003 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.170 g, 1.003 mmol) を加え、室温で3時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール = 10:1) で精製を行い、標題化合物 (0.180 g, 0.350 mmol, 52 %) を得た。

実施例211. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-(1H-ピラゾール-3-イル)アニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-(1H-ピラゾール-3-イル)アニリン (0.090 g, 0.175 mmol) をメタノール (2 ml) , ジクロロメタン (1 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (2 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール = 10:1) で精製を行い、標題化合物 (0.063 g, 0.133 mmol, 98 %) を得た。

ル = 10:1) で精製を行った後、酢酸エチル:ヘキサン混合溶媒 (1:1) にて再結晶を行い、標題化合物 (0.049 g, 0.104 mmol, 59 %) を得た。

実施例212. N-メチル-N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.285 g, 0.762 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、N-メチル-4-トリフルオロメチルアニリン (0.200 g, 1.143 mmol)、トリエチルアミン (0.116 g, 1.143 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.193 g, 1.143 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール = 10:1) で精製を行い、標題化合物 (0.140 g, 0.263 mmol, 35 %) を得た。

実施例213. N-メチル-N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン

N-メチル-N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン (0.138 g, 0.260 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (2 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (酢酸エチル:ヘキサン = 1:2) で精製を行い、標題化合物 (0.075 g, 0.153 mmol, 59 %) を得た。

実施例214. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸 t-ブチルエステル

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-アミノ安息香酸 t-ブチルエステル (0.240 g, 0.437 mmol) をメタノール (5 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 95:5) で精製を行った後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.115 g, 0.227 mmol, 52 %) を得た。

実施例215. N-(2-メトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.300 g, 0.802 mmol) の塩化メチレン溶液 (150 ml) に、3-アミノ-2-メトキシピリジン (0.149 g, 1.203 mmol)、トリエチルアミン (0.122 g, 1.203 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.203 g, 1.203 mmol) を加え、室温で4時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 50:1) で精製を行い、標題化合物 (0.250 g, 0.520 mmol, 65 %) を得た。

実施例216. N-(2-メトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

ミド

N-(2-メトキシピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (0.150 g, 0.312 mmol) をメタノール (5 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (酢酸エチル : ヘキサン = 3:1) で精製を行い、標題化合物 (0.112 g, 0.255 mmol, 82 %) を得た。

実施例217. N-(2-ジメチルアミノピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.281 g, 0.750 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、3-アミノ-2-ジメチルアミノピリジン (0.154 g, 1.125 mmol)、トリエチルアミン (0.114 g, 1.125 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.190 g, 1.125 mmol) を加え、室温で4時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 95:5) で精製を行い、標題化合物 (0.139 g, 0.282 mmol, 38 %) を得た。

実施例218. N-(2-ジメチルアミノピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(2-ジメチルアミノピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

(0.074 g, 0.0933 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (酢酸エチル : ヘキサン = 1:1) で精製を行い、標題化合物 (0.042 g, 0.0930 mmol, 99 %) を得た。

実施例219. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-2,5-ジメトキシアニリン

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.281 g, 0.750 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、2,5-ジメトキシアニリン (0.172 g, 1.125 mmol)、トリエチルアミン (0.114 g, 1.125 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.190 g, 1.125 mmol) を加え、室温で4時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 95:5) で精製を行い、標題化合物 (0.149 g, 0.292 mmol, 39 %) を得た。

実施例220. N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-2,5-ジメトキシアニリン

N-[5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-2,5-ジメトキシアニリン (0.075 g, 0.147 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をエーテル : ヘキサン混合溶媒 (1:1) にて再結晶を行い、標題化合物 (0.048 g, 0.103 mmol, 70

%)を得た。

実施例221. N-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-メトキシベンズアミド

N-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド (0.050 g, 0.113 mmol) をメタノール (5 ml) に溶解し、10 % トリメチルシリルジアゾメタン (ヘキサン溶液) (3.5 ml) を加えた後、室温で2時間攪拌した。反応液を濃縮して得られた残渣をエーテル:ヘキサン混合溶媒 (1:1) にて再結晶を行い、標題化合物 (0.051 g, 0.112 mmol, 99 %) を得た。

実施例222. N-(2-モルホリノピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.281 g, 0.750 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、3-アミノ-2-モルホリノピリジン (0.269 g, 1.500 mmol)、トリエチルアミン (0.197 g, 1.950 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.165 g, 0.975 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (酢酸エチル:ヘキサン = 2:1) で精製を行い、標題化合物 (0.249 g, 0.465 mmol, 62 %) を得た。

実施例223. N-(2-モルホリノピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(2-モルホリノピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル

ル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (0.110 g, 0.205 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をエーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.100 g, 0.203 mmol, 99 %) を得た。

実施例224. N-(6-モルホリノピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.281 g, 0.750 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、3-アミノ-6-モルホリノピリジン (0.269 g, 1.500 mmol)、トリエチルアミン (0.197 g, 1.950 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.165 g, 0.975 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製を行い、標題化合物 (0.239 g, 0.446 mmol, 59 %) を得た。

実施例225. N-(6-モルホリノピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(6-モルホリノピリジン-3-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (0.100 g, 0.187 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、

乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をエーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.089 g, 0.180 mmol, 96 %) を得た。

実施例226. N-(2-クロロピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、4-アミノ-2-クロロピリジン (0.103 g, 1.802 mmol)、トリエチルアミン (0.0812 g, 0.802 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.136 g, 0.802 mmol) を加え、50 °C のオイルバス中で8時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製を行い、標題化合物 (0.078 g, 0.161 mmol, 30 %) を得た。

実施例227. N-(2-クロロピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(2-クロロピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (0.079 g, 0.163 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をエーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.057 g, 0.129 mmol, 79 %) を得た。

実施例228. N-(6-メトキシピリミジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノーン-2-イル)メチル-2-アセトキシベン

ズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.200 g, 0.535 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、4-アミノ-6-メトキシピリミジン (0.134 g, 1.070 mmol)、トリエチルアミン (0.141 g, 1.390 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.118 g, 0.695 mmol) を加え、室温で10時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製を行い、標題化合物 (0.120 g, 0.249 mmol, 47 %) を得た。

実施例229. N-(6-メトキシピリミジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(6-メトキシピリミジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (0.060 g, 0.125 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 10:1) で精製を行った後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.040 g, 0.0910 mmol, 73 %) を得た。

実施例230. N-(2-メトキシピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-

2-アセトキシ安息香酸 (0.250 g, 0.668 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、4-アミノ-2-メトキシピリジン (0.167 g, 1.340 mmol)、トリエチルアミン (0.176 g, 1.740 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.147 g, 0.869 mmol) を加え、室温で10時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール = 10:1) で精製を行った後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.200 g, 0.416 mmol, 62 %) を得た。

実施例231. N-(2-メトキシピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(2-メトキシピリジン-4-イル)-5-(5,6-ジメトキシ-3-メチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (0.100 g, 0.208 mmol) をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム：メタノール = 10:1) で精製を行った後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物 (0.050 g, 0.114 mmol, 55 %) を得た。

実施例232. 5-(2,5-ジメトキシ-3,4,6-トリメチルベンジル)-2-アセトキシ安息香酸

5-(2,5-ジメトキシ-3,4,6-トリメチルベンジル)-2-ヒドロキシ安息香酸 (0.150 g, 0.455 mmol) を無水酢酸 (3 ml) に溶解し、80 °C で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をシリ

カゲルクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 2:1）で精製を行い、標題化合物（0.170 g, 0.454 mmol, 99 %）を得た。

実施例233. 5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸

5-(2,5-ジメトキシ-3,4,6-トリメチルベンジル)-2-アセトキシ安息香酸（1.25 g, 2.56 mmol）をアセトニトリル（30 ml）および水（10 ml）の混合溶液に溶解し、CAN（3.50 g, 6.39 mmol）を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水で希釈し、エーテル抽出した。抽出液は水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 2:1）で精製した後、エーテルにて再結晶を行い、標題化合物（0.800 g, 1.74 mmol, 68 %）を得た。

実施例234. N-[5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン

5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸（0.250 g, 0.730 mmol）の塩化メチレン溶液（100 ml）に、4-トリフルオロメチルアニリン（0.176 g, 1.096 mmol）、トリエチルアミン（0.111 g, 1.096 mmol）および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム（0.185 g, 1.096 mmol）を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール = 10:1）で精製を行った後、酢酸エチル：ヘキサン混合溶媒（1:2）にて再結晶を行い、標題化合物（0.220 g, 0.453 mmol, 62 %）を得た。

実施例235. N-[5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン

N-[5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンゾイル]-4-トリフルオロメチルアニリン (0.070 g, 0.144 mmol) をメタノール (4 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を酢酸エチル:ヘキサン混合溶媒 (1:1) にて再結晶を行い、標題化合物 (0.060 g, 0.135 mmol, 94 %) を得た。

実施例236. N-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド

5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.250 g, 0.730 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、3-アミノ-2-クロロピリジン (0.141 g, 1.096 mmol)、トリエチルアミン (0.111 g, 1.096 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.185 g, 1.096 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール = 10:1) で精製を行った後、酢酸エチル:ヘキサン混合溶媒 (2:1) にて再結晶を行い、標題化合物 (0.149 g, 0.329 mmol, 45 %) を得た。

実施例237. N-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

N-(2-クロロピリジン-3-イル)-5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノ-2-イル)メチル-2-アセトキシベンズアミド (0.0 g, 0.121 mmol) をメタノール (4 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶

媒溜去した。得られた残渣を酢酸エチル:ヘキサン混合溶媒 (1:1) にて再結晶を行い、標題化合物 (0.035 g, 0.0852 mmol, 70 %) を得た。

実施例238. N-(ピリジン-4-イル)-5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-ヒドロキシベンズアミド

5-(3,5,6-トリメチル-1,4-ベンゾキノン-2-イル)メチル-2-アセトキシ安息香酸 (0.250 g, 0.730 mmol) の塩化メチレン溶液 (100 ml) に、4-アミノピリジン (0.103 g, 1.096 mmol)、トリエチルアミン (0.111 g, 1.096 mmol) および塩化2-クロロ-1,3-ジメチルイミダゾリニウム (0.185 g, 1.096 mmol) を加え、室温で12時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、塩化メチレンで抽出した。抽出液を水洗し、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣をメタノール (3 ml) に溶解し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液 (3 ml) を加えた後、室温で3時間攪拌した。反応終了後、水で希釈し、酢酸エチル抽出した。抽出液は、水洗、乾燥した後、溶媒溜去した。得られた残渣を分取用薄層クロマトグラフィー (クロロホルム:メタノール = 95:5) で精製を行い、標題化合物 (0.020 g, 0.049 mmol, 7 %) を得た。

表 1

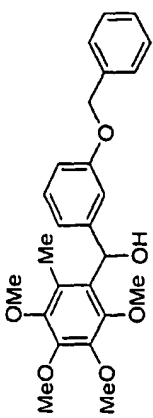
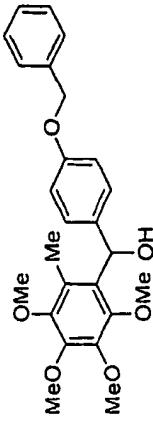
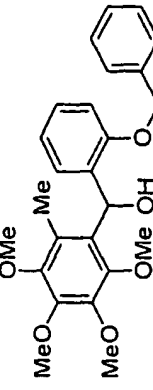
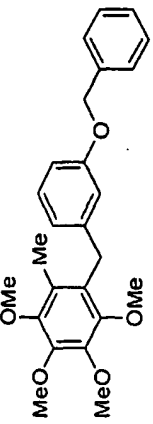
参考例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
ref. 4		無色粉末 80-82°C	424(M ⁺) 90 (100)	2.23 (3H, s), 3.27 (3H, s), 3.81 (3H, s), 3.85 (3H, s), 3.94 (3H, s), 4.03 (1H, d, J=10.8 Hz), 5.05 (2H, s), 5.93 (1H, d, J=10.8 Hz), 6.80-7.00 (3H, m), 7.15-7.40 (6H, m)	3514, 1610, 1582 (KBr)
ref. 5		無色粉末 54-56°C	424(M ⁺) 90 (100)	2.23 (3H, s), 3.35 (3H, s), 3.80 (3H, s), 3.86 (3H, s), 3.94 (3H, s), 4.07 (1H, d, J=10.8 Hz), 5.05 (2H, s), 5.93 (1H, d, J=10.8 Hz), 6.93 (2H, d, J=8.69 Hz), 7.19 (2H, d, J=8.60 Hz), 7.25-7.45 (5H, m)	3568, 2933, 1509 (KBr)
ref. 6		無色油状物	424(M ⁺) 91 (100)	2.16 (3H, s), 3.38 (3H, s), 3.72 (3H, s), 3.75-3.79 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.93 (3H, s), 5.03 (1H, d, J=12.40 Hz), 5.09 (1H, d, J=12.36 Hz), 6.31 (1H, d, J=8.32 Hz), 6.83 (1H, d, J=8.12 Hz), 6.94 (1H, t, J=7.52 Hz), 7.11-7.18 (3H, m), 7.23-7.30 (3H, m), 7.36 (1H, d, J=7.52 Hz)	3500, 2937, 1599, 1464 (KBr)
ref. 7a		無色粉末 77-78°C	408 (M ⁺) 91 (100)	2.06 (3H, s), 3.67 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.98 (2H, s), 5.00 (2H, s), 6.65-6.80 (3H, m), 7.05-7.45 (6H, m)	1601, 1468 (KBr)

表2

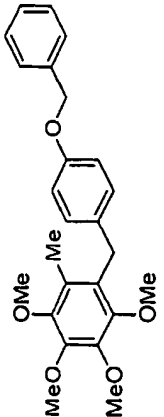
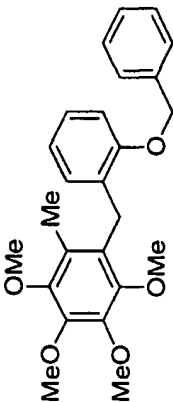
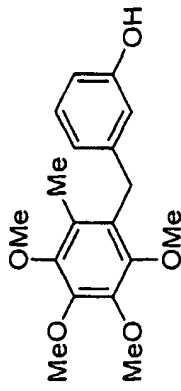
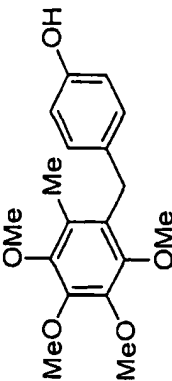
参考文献 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
ref. 8a		無色油状物	408 (M ⁺) 91 (100)	2.08 (3H, s), 3.69 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.94 (2H, s), 5.01 (2H, s), 6.86 (2H, d, J=8.64 Hz), 7.01 (2H, d, J=8.52 Hz), 7.30-7.42 (5H, m)	2935, 1513, 1406 (KBr)
ref. 9a		無色油状物	408 (M ⁺ , 100)	1.94 (3H, s), 3.59 (3H, s), 3.70 (3H, s), 3.84 (3H, s), 3.87 (3H, s), 3.98 (2H, s), 5.06 (2H, s), 6.65 (1H, d, J=7.48 Hz), 7.71 (1H, t, J=7.52 Hz), 6.82 (1H, d, J=8.12 Hz), 7.03 (1H, t, J=8.08 Hz), 7.20-7.31 (3H, m), 7.38 (2H, d, J=7.32 Hz)	2935, 1599, 1465 (NaCl)
ref. 7		無色油状物	318 (M ⁺ , 100)	2.07 (3H, s), 3.70 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.96 (2H, s), 4.76 (1H, s), 6.54 (1H, s), 6.60 (1H, d), 6.68 (1H, d), 7.09 (1H, t)	3387, 1589 (NaCl)
ref. 8		無色粉末 80-81°C	318 (M ⁺ , 100)	2.08 (3H, s), 3.69 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.93 (5H, s), 6.68 (2H, d, J=8.52 Hz), 6.94 (2H, d, J=8.45 Hz)	3372, 1468, 1407 (KBr)

表3

参考文献 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
ref. 9		無色粉末 72.5-74.5 °C	318 (M ⁺ , 100)	2.25 (3H, s), 3.74 (3H, s), 3.87 (2H, s), 3.90 (6H, s), 3.96 (3H, s), 6.79-6.85 (2H, m), 7.10 (1H, t, J=7.60 Hz), 7.21 (1H, d, J=7.48 Hz), 7.63 (1H, br s)	3348, 1466, 1407 (KBr)
ref.10a		無色油状物	346 (M ⁺ , 100)	2.06 (3H, s), 3.72 (3H, s), 3.79 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.02 (2H, s), 6.68 (1H, s), 6.81 (1H, d, J=7.83 Hz), 7.43 (1H, d, J=7.97 Hz), 9.82 (1H, s), 11.04 (1H, s)	3200, 1659, 1627 (KBr)
ref.10b		無色粉末 95-98°C	346 (M ⁺ , 100)	2.06 (3H, s), 3.67 (3H, s), 3.81 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.96 (3H, s), 4.35 (2H, s), 6.28 (1H, d, J=7.6 Hz), 6.80 (1H, d, J=8.4 Hz), 7.31 (1H, t, J=8.0 Hz), 10.59 (1H, s)	3400, 1655 (KBr)
ref. 11		無色粉末 72-73.5	346 (M ⁺ , 100)	2.10 (3H, s), 3.73 (3H, s), 3.79 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.96 (2H, s), 6.89 (1H, d, J=8.53 Hz), 7.24 (1H, s-like), 7.32 (1H, d-like), 9.81 (1H, s), 10.84 (1H, br s)	3232, 1664, 1486 (KBr)

表 4

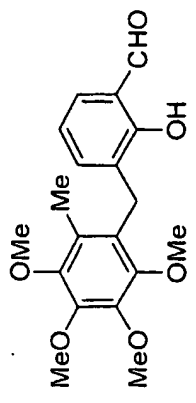
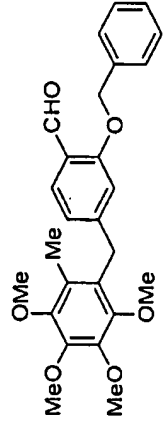
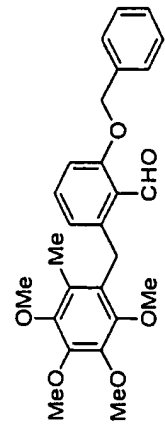
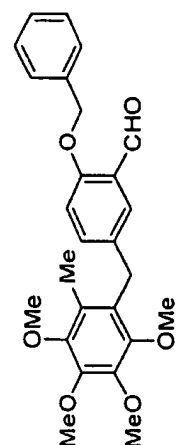
参考文献 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
ref.12		無色粉末 93-95℃	346 (M ⁺ , 100)	2.03 (3H, s), 3.72 (3H, s), 3.80 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.96 (3H, s), 4.00 (2H, s), 6.86 (1H, t, J=7.56 Hz), 6.93 (1H, d, J=7.08 Hz), 7.39 (1H, d, J=7.28 Hz), 9.91 (1H, s), 11.46 (1H, s)	3446, 1661, 1468 (KBr)
ref.13		無色粉末 95-98℃	436 (M ⁺) 154 (100)	2.03 (3H, s), 3.64 (3H, s), 3.79 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.96 (3H, s), 4.01 (2H, s), 5.10 (2H, s), 6.76 (1H, s), 6.79 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.20-7.50 (5H, m), 7.73 (1H, d, J=7.9 Hz), 10.47 (1H, s)	1688, 1605 (KBr)
ref. 14		無色粉末 68-70℃	436 (M ⁺) 91 (100)	1.97 (3H, s), 3.68 (3H, s), 3.79 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.96 (3H, s), 4.40 (2H, s), 5.17 (2H, s), 6.35 (1H, d, J=7.8 Hz), 6.89 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.20-7.50 (6H, m), 10.85 (1H, s)	1684, 1654 (KBr)
ref. 15		無色油状物	436 (M ⁺ +1) 91 (100)	2.07 (3H, s), 3.71 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.95 (2H, s), 5.15 (2H, s), 6.93 (1H, d, J=8.60 Hz), 7.15-7.50 (6H, m), 7.64 (1H, d, J=2.23 Hz), 10.52 (1H, s)	2936, 1682, 1608 (KBr)

表 5

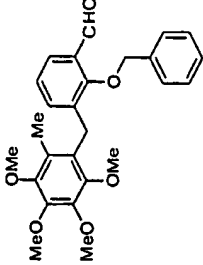
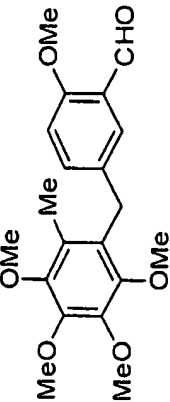
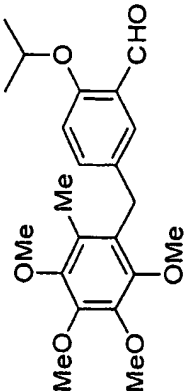
参考例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
ref. 16		無色油状物	436 (M ⁺) 91 (100)	2.03 (3H, s), 3.69 (3H, s), 3.79 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.06 (2H, s), 5.11 (2H, s), 7.00 (1H, d, J=7.26 Hz), 7.09 (1H, t, J=7.64 Hz), 7.37-7.49 (5H, m), 7.69 (1H, d, J=7.60 Hz), 10.33 (1H, s)	2935, 1687, 1467 (NaCl)
ref 17		無色油状物	360 (M ⁺ , 100)	2.07 (3H, s), 3.72 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.88 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.96 (2H, s), 6.88 (1H, d, J=8.60 Hz), 7.27 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.62 (1H, d, J=2.28 Hz), 10.43 (1H, s)	1609, 1464 (NaCl)
ref. 18		無色油状物	388 (M ⁺ , 100)	1.37 (6H, d, J=6.00 Hz), 2.07 (3H, s), 3.72 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.95 (2H, s), 4.59-4.62 (1H, m), 6.87 (1H, d, J=8.64 Hz), 7.24 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.61 (1H, s), 10.44 (1H, s)	1684, 1468 (NaCl)

表6

实施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
1		無色粉末 104-105°C	452 (M ⁺) 154 (100)	2.04 (3H, s), 3.67 (3H, s), 3.80 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.96 (3H, s), 4.02 (2H, s), 5.20 (2H, s), 6.84 (1H, s), 6.90 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.20-7.45 (5H, m), 8.06 (1H, d, J=8.0 Hz)	3428, 1698, 1609 (KBr)
2		無色油状物	452 (M ⁺) 91 (100)	2.04 (3H, s), 3.65 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.90 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.14 (2H, s), 5.16 (2H, s), 6.40 (1H, d, J=7.85 Hz), 6.82 (1H, d, J=8.29 Hz), 7.10-7.50 (6H, m)	3200, 1732, 1704 (NaCl)
3		無色粉末 70.0-71.5°C	452 (M ⁺) 91 (100)	2.07 (3H, s), 3.73 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.98 (2H, s), 5.24 (2H, s), 7.00 (1H, d, J=8.60 Hz), 7.23 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.41 (5H, s), 8.03 (1H, s), 10.52-10.87 (1H, br)	3300, 1736, 1466 (NaCl)
4		無色油状物	452 (M ⁺) 91 (100)	1.98 (3H, s), 3.69 (3H, s), 3.79 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.95 (3H, s), 4.08 (2H, s), 5.14 (2H, s), 6.97 (1H, d, J=7.52 Hz), 7.09 (1H, t, J=7.68 Hz), 7.35-7.43 (3H, m), 7.55 (2H, d, J=7.20 Hz), 7.91 (1H, d, J=7.64 Hz)	3064, 1694, 1469 (NaCl)

表 7

実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
5		無色油状物	520 (M ⁺) 91 (100)	1.25-1.65 (6H, m), 2.02 (3H, s), 3.10-3.25 (2H, m), 3.60-3.80 (2H, m), 3.66 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.95 (3H, s), 3.96 (2H, s), 5.01 (2H, d, J=11.8 and 19.5 Hz), 6.68 (1H, s), 6.72 (1H, d, J=7.8 Hz), 7.11 (1H, d=7.7 Hz), 7.20-7.40 (5H, m)	1609 (CH ₃ Cl)
6		無色油状物	520 (M ⁺ +1) 91 (100)	1.26-1.56 (6H, m), 2.08 (3H, s), 3.70-3.76 (7H, m), 3.77 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.94 (2H, s), 5.03 (1H, d, 12.08 Hz), 5.08 (1H, d, J=12.08 Hz), 6.82 (1H, d, J=9.12 Hz), 7.00-7.02 (2H, m), 7.28-7.38 (5H, m)	1635, 1471, 1406 (NaCl)
7		無色油状物	522 (M ⁺ +1) 91 (100)	2.07 (3H, s), 3.20-3.26 (2H, m), 3.45-3.47 (2H, m), 3.59-3.82 (4H, m), 3.71 (3H, s), 3.77 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.94 (2H, s), 5.04 (2H, s like), 6.84 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.02-7.06 (2H, m), 7.28-7.38 (5H, m)	1634, 1464, 1406 (NaCl)
8		無色結晶 116-117 °C	557 (M ⁺) 152 (100)	2.10 (3H, s), 3.74 (3H, s), 3.77 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.94 (3H, s), 4.02 (2H, s), 5.17 (2H, s), 6.75 (2H, d, J=9.00 Hz), 7.00 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.14-7.25 (5H, m), 7.44-7.50 (4H, m), 8.17-8.18 (1H, br)	3345, 1663, 1513, 1464, 1239 (KBr)

表 8

実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
9		無色粉末 133-135°C	362 (M ⁺) 154 (100)	2.05 (3H, s), 3.70 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.98 (2H, s), 6.60-6.75 (2H, m), 7.73 (1H, d, J=8.2 Hz)	1659, 1622 (KBr)
10		無色粉末 147-151 °C	362 (M ⁺) 154 (100)	2.09 (3H, s), 3.73 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.94 (5H, s), 6.88 (1H, d, J=8.60 Hz), 7.24-7.25 (1H, m), 7.65 (1H, s)	3426, 1672, 1456 (KBr)
11		無色結晶 87-90 °C	362 (M ⁺ , 100)	2.04 (3H, s), 3.73 (3H, s), 3.81 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.96 (3H, s), 4.01 (2H, s), 6.76 (1H, t, J=7.72 Hz), 6.90 (1H, d, J=7.02 Hz), 7.76 (1H, d, J=7.16 Hz), 10.91 (1H, s)	3084, 1674, 1468 (NaCl)
12		無色粉末 83-85°C	404 (M ⁺ , 100)	2.08 (3H, s), 2.30 (3H, s), 3.69 (3H, s), 3.79 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.94 (3H, s), 4.04 (2H, s), 6.86 (1H, s), 7.07 (1H, d, J=8.4 Hz), 7.96 (1H, t, J=8.1 Hz)	3200, 1772, 1617 (KBr)

表9

実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
13		無色油状物	404 (M ⁺ , 100)	2.10 (3H, s), 2.30 (3H, s), 3.73 (3H, s), 3.79 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.94 (3H, s), 4.02 (2H, s), 6.99 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.31 (1H, d, J=8.32 Hz), 7.90 (1H, s)	3200, 1770, 1716 (NaCl)
14		無色油状物	404 (M ⁺ , 100)	2.02 (3H, s), 2.39 (3H, s), 3.67 (3H, s), 3.80 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.95 (2H, s), 7.03 (1H, d, J=7.56 Hz), 7.17 (1H, t, J=7.72 Hz), 7.93 (1H, d, J=7.68 Hz), 10.30-11.00 (1H, br, s)	3150, 1772, 1467 (NaCl)
15		無色結晶 74-76 °C	376 (M ⁺ +1, 100)	2.09 (3H, s), 3.71 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.92 (5H, s), 3.94 (3H, s), 6.86 (1H, d, J=8.55 Hz), 7.19 (1H, dd, J=8.51 and 2.11 Hz), 7.59 (1H, d, J=1.98 Hz), 10.57 (1H, s)	3426, 1672, 1469 (KBr)
16		無色油状物	376 (M ⁺) 54 (100)	2.07 (3H, s), 3.73 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.98 (2H, s), 4.03 (3H, s), 6.93 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.23 (1H, d, J=8.60 Hz), 8.01 (1H, s), 10.72 (1H, br s)	3274, 1733, 1465 (NaCl)

表10

実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
17		無色油状物	404 (M ⁺ , 100)	1.45 (6H, d, J=6.08 Hz), 2.07 (3H, s), 3.73 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.98 (2H, s), 4.76-4.80 (1H, m), 6.92 (1H, d, J=8.60 Hz), 7.22 (1H, d, J=8.60 Hz), 8.01 (1H, s), 11.23 (1H, br s)	3244, 1738, 1467 (NaCl)
18		無色油状物	452 (M ⁺ +1, 100)	2.11 (3H, s), 3.74 (3H, s), 3.75 (3H, s), 3.79 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.93 (3H, s), 4.01 (2H, s), 6.87-6.92 (3H, m), 7.02 (1H, t, J=7.40 Hz), 7.17 (1H, dd, J=8.44 and 2.08 Hz), 7.26 (2H, t, J=8.80 Hz), 7.71 (1H, d, J=2.00 Hz)	2936, 1735, 1486, 1243 (NaCl)
19		無色油状物	482 (M ⁺) 73 (100)	2.10 (3H, s), 3.73 (3H, s), 3.75 (3H, s), 3.77 (3H, s), 3.79 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.94 (3H, s), 4.00 (2H, s), 6.41-6.50 (2H, m), 6.59 (1H, dd, J=8.22 and 2.16 Hz), 6.89 (1H, d, J=8.44 Hz), 7.09-7.19 (2H, m), 7.71 (1H, d, J=1.96 Hz)	1712, 1599, 1486, 1147 (NaCl)
20		無色油状物	467 (M ⁺) 89 (100)	2.09 (3H, s), 3.71 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.87 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.96 (2H, s), 5.12 (2H, s), 6.90 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.15 (1H, dd, J=8.56 and 2.00 Hz), 7.28-7.32 (1H, m), 7.64 (1H, d, J=2.04 Hz), 7.86 (1H, d, J=7.80 Hz), 8.55 (1H, d, J=4.32 Hz), 8.69 (1H, br s)	1727, 1465, 1406, 1259 (NaCl)

表 11

実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
21		無色油状物	468 (M ⁺ + 1) 179 (100)	2.09 (3H, s), 3.72 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.89 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.96 (2H, s), 5.10 (2H, s), 6.84 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.15 (1H, dd, J=8.48 and 2.00 Hz), 7.42 (2H, d, J=5.48 Hz), 7.67 (1H, d, J=1.96 Hz), 8.59 (2H, d, J=5.72 Hz)	1727, 1467, 1406, 1260 (NaCl)
22		無色油状物	490 (M ⁺) 54 (100)	1.35 (9H, s), 1.98 (3H, s), 3.60 (3H, s), 3.67 (3H, s), 3.77 (3H, s), 3.81 (3H, s), 3.83 (3H, s), 3.85 (2H, s), 4.45 (2H, s), 6.65 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.03 (1H, dd, J=8.48 and 1.40 Hz), 7.51 (1H, d like)	1732, 1467, 1155 (NaCl)
23		無色油状物	438 (M ⁺ + 1, 100)	2.08 (3H, s), 3.74 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.93 (3H, s), 4.00 (2H, s), 6.73 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.05 (2H, d, J=7.88 Hz), 7.15 (1H, dd, J=8.60 and 2.20 Hz), 7.19 (1H, t, J=7.40 Hz), 7.37 (2H, t, J=7.88 Hz), 7.98 (1H, d, J=1.96 Hz)	3300, 1698, 1486, 1241 (NaCl)
24		無色油状物	468 (M ⁺) 69 (100)	2.07 (3H, s), 3.71 (3H, s), 3.72 (3H, s), 3.77 (3H, s), 3.90 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.97 (2H, s), 6.54-6.57 (2H, m), 6.44 (1H, d, J=8.52 Hz), 6.74 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.09 (1H, d, J=8.24 Hz), 7.16 (1H, t, J=8.12 Hz), 7.89 (1H, d like)	3450, 1698, 1605, 1486, 1140 (NaCl)

表 12

実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
25		無色結晶 129-132 °C	453 (M ⁺) 93 (100)	2.08 (3H, s), 3.72 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.99 (2H, s), 5.23 (2H, s), 6.96 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.19 (1H, d, J=7.80 Hz), 7.30-7.39 (1H, m), 7.77 (1H, d, J=7.64 Hz), 7.95 (1H, br s), 8.60-8.75 (1H, br), 8.90-9.00 (1H, br)	3425, 1700, 1467, 1261 (KBr)
26		無色結晶 174-176 °C	454 (M ⁺ + 1) 179 (100)	2.07 (3H, s), 3.73 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.98 (2H, s), 5.26 (2H, s), 6.87 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.19 (1H, d, J=8.44 Hz), 7.39 (2H, d, J=5.24 Hz), 7.98 (1H, br s), 8.66 (2H, d, J=5.56 Hz)	3427, 1693, 1468, 1257 (NaCl)
27		無色結晶 184-188 °C	430 (M ⁺ + 1) 69 (100)	1.53-1.56 (4H, m), 1.62-1.65 (2H, m), 2.07 (3H, s), 3.52-3.54 (4H, m), 3.70 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.90 (3H, s), 3.92 (5H, s like), 6.85 (1H, s), 6.90 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.15 (1H, d, J=8.36 Hz), 9.49 (1H, br s)	3430, 1568, 1469, 1408 (KBr)
28		無色結晶 185-188 °C	432 (M ⁺ + 1) 154 (100)	2.07 (3H, s), 3.64 (8H, m), 3.72 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.91 (2H, s), 3.92 (3H, s), 3.93 (3H, s), 6.86 (1H, s), 6.91 (1H, d, J=8.44 Hz), 7.15 (1H, dd, J=8.36 and 2.12 Hz), 9.31 (1H, br s)	3448, 1570, 1466 (KBr)

表 13

実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
29		無色油状物	522 (M ⁺ + 1, 100)	1.36-1.39 (2H, m), 1.45-1.60 (4H, m), 3.14-3.17 (2H, m), 3.66-3.77 (4H, m), 3.70 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.95 (2H, s), 5.07 (2H, s), 6.84 (1H, d, J=8.28 Hz), 7.01-7.04 (2H, m), 7.28-7.29 (2H, m), 7.74 (1H, d, J=7.88 Hz), 8.55-8.62 (2H, m)	2936, 1624, 1472, 1405 (NaCl)
30		無色油状物	521 (M ⁺ + 1) 69 (100)	1.24-1.27 (2H, m), 1.38-1.43 (4H, m), 2.07 (3H, s), 3.18 (2H, t, J=5.60 Hz), 3.68-3.89 (2H, m), 3.70 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.94 (2H, s), 5.05 (1H, d, J=13.56 Hz), 5.10 (1H, d, J=13.60 Hz), 6.76 (1H, d, J=9.16 Hz), 7.00-7.02 (2H, m), 7.31 (2H, d, J=5.56 Hz), 8.58 (2H, d, J=5.44 Hz)	2937, 1624, 1467 (NaCl)
31		無色油状物	507 (M ⁺ + 100)	1.55-1.63 (6H, m), 2.09 (3H, s), 3.22-3.26 (2H, m), 3.59-3.63 (2H, m), 3.73 (3H, s), 3.79 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.99 (2H, s), 6.81 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.08 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.12 (1H, s), 7.20-7.28 (2H, m), 8.32 (1H, d, J=3.96 Hz), 8.38 (1H, d, J=2.36 Hz)	2936, 1630, 1468 (NaCl)
32		無色油状物	507 (M ⁺) 69 (100)	1.43-1.62 (6H, m), 2.10 (3H, s), 3.20-3.21 (2H, m), 3.55-3.57 (2H, m), 3.74 (3H, s), 3.80 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.94 (3H, s), 4.02 (2H, s), 6.82 (2H, d, J=5.72 Hz), 6.94 (1H, d, J=6.04 Hz), 7.14-7.16 (2H, m), 8.43 (2H, d, J=5.56 Hz)	2935, 1631, 1467 (NaCl)

表14

实施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
33		無色油状物	502 (M ⁺ + 1) 54 (100)	1.26-1.63 (6H, m), 2.07 (3H, s), 3.18-3.26 (2H, m), 3.29-3.75 (2H, m), 3.70 (3H, s), 3.75 (3H, s), 3.77 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.93 (5H, s), 4.61-4.62 (2H, m), 6.65 (1H, d, J=9.00 Hz), 7.00-7.02 (2H, m)	1760, 1626, 1468, 1207 (NaCl)
34		無色油状物	544 (M ⁺ + 1) 54 (100)	1.38-1.63 (6H, m), 1.46 (9H, s), 2.07 (3H, s), 3.17-3.29 (2H, m), 3.61-3.81 (2H, m), 3.69 (3H, s), 3.77 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.93 (5H, s), 4.44 (1H, d, J=16.24 Hz), 5.01 (1H, d, J=16.08 Hz), 6.62 (1H, d, J=8.80 Hz), 6.99-7.01 (2H, m)	1751, 1628, 1468, 1156 (NaCl)
35		無色油状物	522 (M ⁺) 431 (100)	2.07 (3H, s), 3.21-3.23 (2H, m), 3.46-3.49 (2H, m), 3.60-3.75 (4H, m), 3.71 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.95 (2H, s), 5.07 (2H, s), 6.86 (1H, d, J=9.12 Hz), 7.05-7.07 (2H, m), 7.29-7.30 (1H, m), 7.73 (1H, d, J=7.80 Hz), 8.56 (1H, d, J=4.44 Hz), 8.62 (1H, s)	2934, 1636, 1465 (NaCl)
36		無色油状物	523 (M ⁺ + 1) 93 (100)	2.07 (3H, s), 3.24-3.29 (2H, m), 3.51-3.54 (2H, m), 3.71-3.82 (4H, m), 3.71 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.95 (2H, s), 5.08-5.09 (2H, m), 6.78 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.04-7.06 (2H, m), 7.30 (2H, d, J=5.52 Hz), 8.59 (2H, d, J=5.60 Hz)	2935, 1645, 1484 (NaCl)

表 15

実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
37		無色油状物	509 (M ⁺ +1) 73 (100)	2.02 (3H, s), 3.25-3.28 (2H, m), 3.53-3.72 (6H, m), 3.67 (3H, s), 3.72 (3H, s), 3.84 (3H, s), 3.86 (3H, s), 3.92 (2H, s), 6.74 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.02 (1H, d, J=8.42 Hz), 7.08 (1H, s), 7.16-7.19 (2H, m), 8.27 (1H, d like), 8.29 (1H, d like)	2933, 1631, 1468 (NaCl)
38		無色油状物	509 (M ⁺ +1) 52 (100)	2.10 (3H, s), 3.29-3.31 (2H, m), 3.59-3.70 (6H, m), 3.75 (3H, s), 3.80 (3H, s), 3.93 (3H, s), 3.94 (3H, s), 4.02 (2H, s), 6.81 (2H, d, J=6.12 Hz), 6.96 (1H, d, J=8.24 Hz), 7.17-7.20 (2H, m), 8.44 (2H, d, J=5.64 Hz)	2931, 1631, 1467 (NaCl)
39		無色油状物	504 (M ⁺ +1, 100)	2.07 (3H, s), 3.23-3.76 (8H, m), 3.71 (3H, s), 3.76 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.93 (5H, s), 4.64 (2H, s), 6.63 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.05 (1H, d like), 7.30 (1H, s)	1758, 1632, 1466, 1209 (NaCl)
40		無色油状物	545 (M ⁺) 54 (100)	1.46 (9H, s), 2.07 (3H, s), 3.20-3.78 (8H, m), 3.70 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.91 (3H, s), 3.93 (5H, s), 4.50-4.51 (2H, m), 6.61 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.01-7.07 (2H, m)	1749, 1633, 1467, 1222 (NaCl)

表16

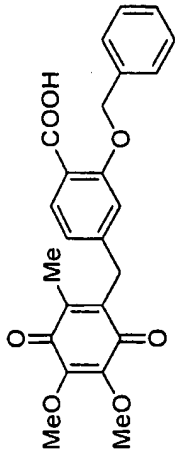
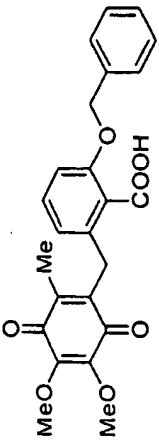
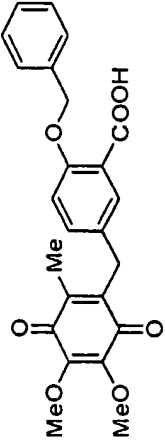
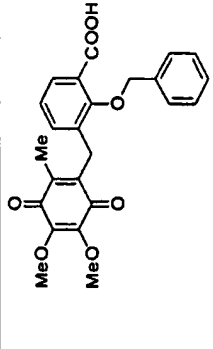
実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
41		黄色粉末 139-140°C	423(M ⁺ +1) 154 (100)	2.03 (3H, s), 3.85 (2H, s), 4.00 (3H, s), 4.01 (3H, s), 5.27 (2H, s), 6.90-7.00 (2H, m), 7.30-7.50 (5H, m), 8.08 (1H, d, J=8.2)	3450, 1703, 1644, 1605 (KBr)
42		黄色粉末 129-130°C	423(M ⁺ +1) 154 (100)	2.01 (3H, s), 3.96 (3H, s), 4.01 (3H, s), 4.03 (2H, s), 5.17 (2H, s), 6.59 (1H, d, J=7.8 Hz), 6.88 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.20-7.50 (6H, m)	3436, 1648, 1610 (KBr)
43		黄色結晶 93.0-94.0 °C	423 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.09 (3H, s), 3.83 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 5.26 (2H, s), 7.04 (1H, d, J=8.00 Hz), 7.36-7.39 (1H, m), 7.39-7.42 (5H, m), 7.97 (1H, d, J=2.40 Hz)	3448, 1736, 1654, 1612 (KBr)
44		黄色結晶 154-156 °C	423 (M ⁺ +1) 91 (100)	1.92 (3H, s), 3.91 (2H, s), 3.97 (3H, s), 4.00 (3H, s), 5.13 (2H, s), 7.13-7.17 (2H, m), 7.35-7.49 (5H, m), 7.92-7.93 (1H, m)	3206, 1723, 1647, 1619 (KBr)

表 17

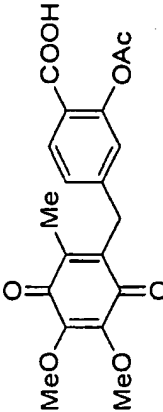
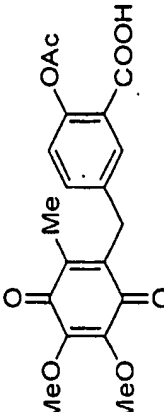
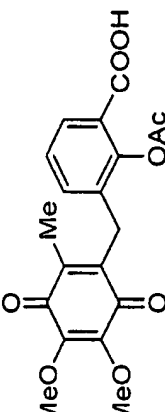
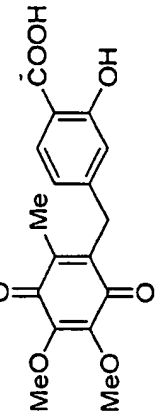
実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
45		黄色結晶 80-81 °C	375 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.09 (3H, s), 2.32 (3H, s), 3.89 (2H, s), 4.00 (6H, s), 6.94 (1H, s), 7.16 (1H, d, J=8.1 Hz), 8.00 (1H, d, J=8.1 Hz)	3100, 1745, 1690, 1667, 1609 (KBr)
46		赤色結晶 108-110 °C	375 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.12 (3H, s), 2.32 (3H, s), 3.88 (2H, s), 4.00 (6H, s), 7.03 (1H, d, J=8.28 Hz), 7.44 (1H, dd, J=8.32 and 2.16 Hz), 7.91 (1H, d, J=2.08 Hz)	3428, 1772, 1687, 1612 (KBr)
47		赤色結晶 83-85 °C	375 (M ⁺ +1) 154 (100)	1.97 (3H, s), 2.32 (3H, s), 3.80 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.21-7.32 (2H, m), 7.93 (1H, d, J=7.56 Hz), 9.30-9.80 (1H, br)	3400, 1767, 1654, 1612 (KBr)
48		黄色粉末 157-158 °C	333 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.02 (3H, s), 3.81 (2H, s), 3.96 (3H, s), 3.97 (3H, s), 6.55-6.70 (2H, s), 7.74 (1H, d, J=8.0 Hz)	3464, 1646 (KBr)

表 18

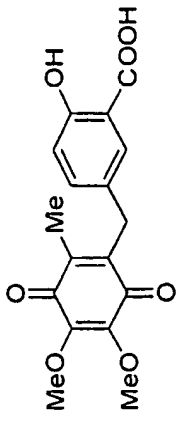
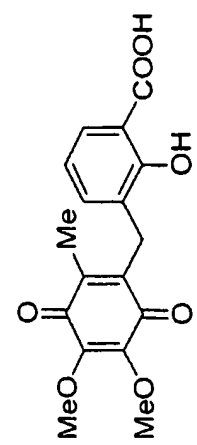
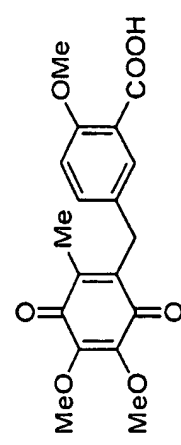
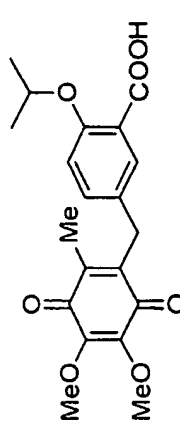
実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
49		黄色結晶 206-207 °C	333 (M ⁺ + 1) 154 (100)	2.06 (3H, s), 3.78 (2H, s), 3.95 (3H, s), 3.96 (3H, s), 6.76 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.20 (1H, dd, J=8.44 and 2.00 Hz), 7.63 (1H, d, J=1.76 Hz) (in CD3OD)	3402, 1652, 1611 (KBr)
50		黄色結晶 109-111.5 °C	333 (M ⁺ + 1) 154 (100)	1.99 (3H, s), 3.82 (2H, s), 4.00 (3H, s), 4.01 (3H, s), 7.23-7.27 (1H, m), 7.34-7.36 (1H, m), 7.98 (1H, d, J=7.64 Hz)	3450, 1653, 1614 (KBr)
51		黄色結晶 127-129 °C	347 (M ⁺ + 1) 154 (100)	2.09 (3H, s), 3.83 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.05 (3H, s), 6.97 (1H, d, J=8.60 Hz), 7.41 (1H, dd, J=8.52 and 2.40 Hz), 7.95 (1H, d, J=2.32 Hz), 10.40-11.20 (1H, br)	3446, 1699, 1650, 1605 (KBr)
52		黄色油状物	375 (M ⁺ + 1) 154 (100)	1.46 (6H, d, J=6.12 Hz), 2.09 (3H, s), 3.82 (2H, s), 3.99 (6H, s), 4.79-4.85 (1H, m), 6.96 (1H, d, J=8.64 Hz), 7.38 (1H, dd, J=8.48 and 2.36 Hz), 7.96 (1H, d, J=2.36 Hz), 11.16 (1H, br s)	3246, 1736, 1648, 1611 (NaCl)

表 19

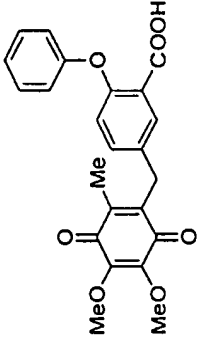
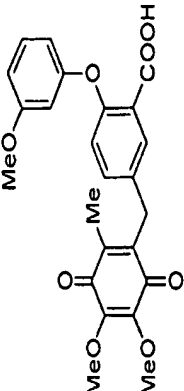
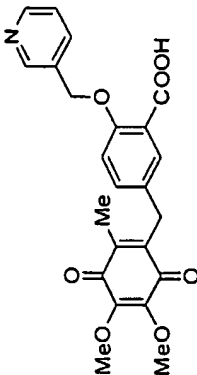
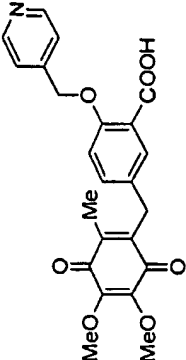
实施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCI ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
53		黄色結晶 102-105 °C	409 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.09 (3H, s), 3.83 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.77 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.04 (2H, d, J=7.88 Hz), 7.19 (2H, t, J=7.36 Hz), 7.28 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.37 (2H, t, J=7.60 Hz), 7.92 (1H, br s)	3415, 1652, 1613, 1487 (KBr)
54		黄色結晶 142-144 °C	439 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.10 (3H, s), 3.80 (3H, s), 3.84 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.63-6.66 (2H, m), 6.78-6.81 (2H, m), 7.25-7.32 (2H, m), 7.95-7.98 (1H, m)	3428, 1706, 1649, 1608, 1490 (KBr)
55		黄色結晶 187-190 °C	424 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.11 (3H, s), 3.84 (2H, s), 3.99 (6H, s), 5.26 (2H, s), 7.02 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.38-7.44 (2H, m), 7.78 (1H, d, J=7.96 Hz), 7.94 (1H, d, J=2.24 Hz), 8.77 (1H, d, J=4.32 Hz), 8.98 (1H, br s)	3430, 1648, 1612 (KBr)
56		黄色結晶 178-181 °C	424 (M ⁺ +1) 154 (100)	1.98 (3H, s), 3.77 (2H, s), 3.88 (3H, s), 3.89 (3H, s), 5.35 (2H, s), 7.07 (1H, d, J=8.60 Hz), 7.30 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.53 (1H, d, J=1.56 Hz), 7.77-7.78 (2H, d like), 8.74-8.75 (2H, d like)	3414, 1718, 1658, 1612 (KBr)

表20

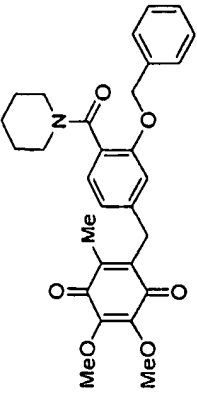
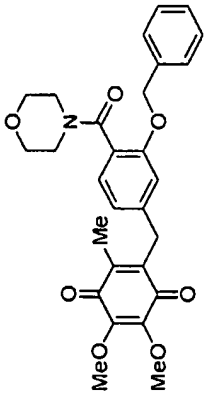
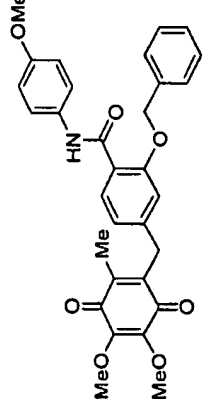
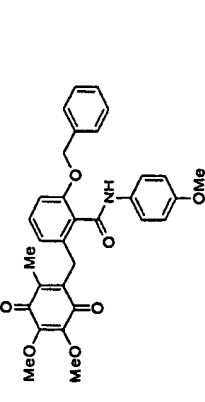
実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
57		黄色油状物	490 (M ⁺ +1) 154 (100)	1.20-1.90 (6H, m), 1.99 (3H, s), 3.05-3.30 (2H, m), 3.60-3.85 (2H, m), 3.79 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 5.00-5.15 (2H, m), 6.73 (1H, s), 6.78 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.13 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.20-7.45 (5H, m)	1608 (NaCl)
58		黄色粉末 58-60°C	492 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.01 (3H, s), 3.10-3.35 (2H, m), 3.40-3.55 (2H, m), 3.55-3.90 (4H, m), 3.80 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 5.07 (2H, s), 6.77 (1H, s), 6.80 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.17 (1H, d, J=7.7 Hz), 7.20-7.45 (5H, m)	1644, 1609 (KBr)
59		黄色粉末 149-150°C	528 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.09 (3H, s), 3.76 (3H, s), 3.89 (2H, s), 4.01 (6H, s), 5.20 (2H, s), 6.75 (2H, d, J=8.9 Hz), 6.93 (1H, d, J=8.1 Hz), 6.98 (1H, s), 7.19 (2H, d), 7.35-7.55 (5H, m), 8.21 (1H, d, J=8.0 Hz), 9.78 (1H, s)	1654, 1608 (KBr)
60		黄色粉末 129-130°C	528 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.09 (3H, s), 3.82 (3H, s), 3.95 (3H, s), 3.96 (2H, s), 3.99 (3H, s), 5.13 (2H, s), 6.58 (1H, d), 6.80-6.95 (3H, m), 7.19 (1H, t), 7.20-7.45 (5H, m), 7.51 (2H, d), 8.18 (1H, s)	1643, 1611 (KBr)

表21

実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
61		赤黄色油状物	490 (M ⁺ +1) 154 (100)	1.38-1.90 (6H, m), 2.06 (3H, s), 3.11-3.21 (2H, m), 3.56-3.84 (4H, m), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 5.04 (1H, d, 12.04 Hz), 5.09 (1H, d, J=12.12 Hz), 6.82 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.03 (1H, d, J=2.12 Hz), 7.11 (1H, dd, J=8.48 and 2.12 Hz), 7.27-7.38 (5H, m)	1644, 1614, 1456 (NaCl)
62		赤黄色油状物	492 (M ⁺ +1) 91 (100)	1.99 (3H, s), 3.12-3.18 (2H, m), 3.40-3.42 (2H, m), 3.53-3.75 (6H, m), 3.91 (3H, s), 3.92 (3H, s), 4.98 (2H, s), 6.79 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.00 (1H, d, J=2.20 Hz), 7.08 (1H, dd, J=8.52 and 2.16 Hz), 7.24-7.29 (5H, m)	1640, 1612, 1440 (NaCl)
63		黄色結晶 113-115 °C	528 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.11 (3H, s), 3.76 (3H, s), 3.85 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 5.17-5.18 (2H, m), 6.74 (2H, d, J=9.04 Hz), 7.03 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.18 (2H, d, J=9.04 Hz), 7.33 (1H, d, J=8.44 Hz), 7.44-7.50 (5H, m), 8.11 (1H, s), 9.84 (1H, br s)	3356, 1664, 1611, 1512 (KBr)
64		黄色油状物	490 (M ⁺ +1) 154 (100)	1.38-1.62 (6H, m), 1.90 (3H, s), 3.14-3.19 (2H, m), 3.57-3.78 (2H, m), 3.79-3.90 (2H, m), 3.97 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.98 (1H, d, 11.00 Hz), 5.09 (1H, d, J=11.04 Hz), 6.94 (1H, d, J=7.16 Hz), 7.05 (1H, t, J=7.60 Hz), 7.17 (1H, d, J=7.20 Hz), 7.32-7.43 (5H, m)	1628, 1610, 1436, 1267 (NaCl)

表22

实施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
65		黄色油状物	492 (M ⁺ +1) 91 (100)	1.92 (3H, s), 3.16-3.22 (2H, m), 3.48-3.85 (6H, m), 3.78-3.95 (2H, m), 3.98 (3H, s), 4.00 (3H, s), 5.03 (2H, s), 6.96 (1H, d, J=7.48 Hz), 7.08 (1H, t, J=7.64 Hz), 7.20 (1H, d, J=7.40 Hz), 7.34-7.43 (5H, m)	1634, 1611, 1434 (NaCl)
66		黄色結晶 138.5-140 °C	528 (M ⁺ +1) 154 (100)	1.93 (3H, s), 3.72 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.92 (3H, s), 3.95 (3H, s), 5.01 (2H, s), 6.75 (2H, d, J=8.92 Hz), 6.98 (1H, d, J=7.40 Hz), 7.11 (1H, d, J=7.68 Hz), 7.29-7.35 (7H, m), 7.94 (1H, d, J=7.28 Hz), 9.38 (1H, br s)	3286, 1649, 1611, 1516 (KBr)
67		黄色結晶 147-148 °C	480 (M ⁺ +1) 154(100)	2.10 (3H, s), 2.33 (3H, s), 3.82 (3H, s), 3.88 (2H, s), 4.00 (6H, s), 6.88 (2H, d), 6.97 (1H, s), 7.17 (1H, d), 7.47 (2H, d), 7.76 (1H, d), 8.86 (1H, s)	1767, 1654, 1611 (KBr)
68		赤色油状物	442 (M ⁺ +1) 154 (100)	1.24-1.87 (6H, m), 2.07 (3H, s), 2.25 (3H, s), 3.18-3.20 (2H, m), 3.56-3.98 (4H, m), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.84-7.10 (2H, m), 7.21 (1H, d, J=8.00 Hz)	1766, 1650, 1614 (NaCl)

表23

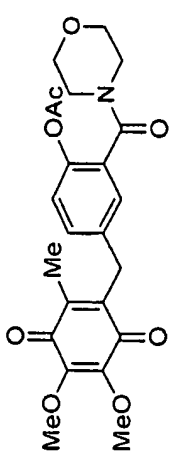
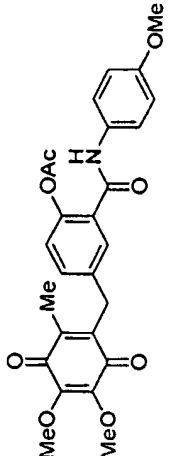
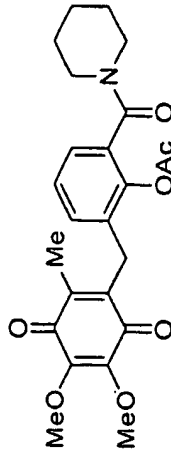
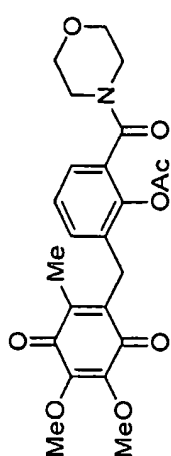
実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
69		赤色油状物	444 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.09 (3H, s), 2.67 (3H, s), 3.20-3.30 (2H, m), 3.56-3.84 (8H, m), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.05 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.11 (1H, d, J=1.84 Hz), 7.24 (1H, dd, J=8.34 and 1.88 Hz)	1766, 1644, 1612 (NaCl)
70		黄色結晶 170-171.5 °C	480 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.10 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.80 (3H, s), 3.86 (2H, s), 3.99 (6H, s), 6.89 (2H, d, J=8.80 Hz), 7.05 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.32 (1H, dd, J=8.24 and 1.72 Hz), 7.48 (2H, d, J=8.80 Hz), 7.64 (1H, s), 7.96 (1H, br s)	3496, 1766, 1644, 1612 (KBr)
71		黄色油状物	442 (M ⁺ +1) 136 (100)	1.50-1.63 (6H, m), 1.97 (3H, s), 2.28 (3H, s), 3.15-3.25 (2H, m), 3.60-3.70 (2H, m), 3.76 (2H, s), 4.00 (3H, s), 4.01 (3H, s), 7.06-7.18 (3H, m)	1766, 1636, 1610 (NaCl)
72		黄色油状物	444 (M ⁺ +1) 154 (100)	1.98 (3H, s), 2.29 (3H, s), 3.31-3.39 (2H, m), 3.59-3.83 (6H, m), 3.77 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.09-7.19 (3H, m)	1766, 1644, 1613 (NaCl)

表24

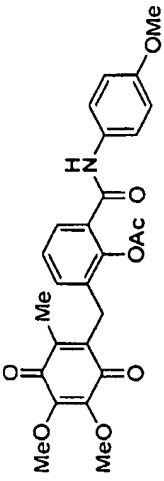
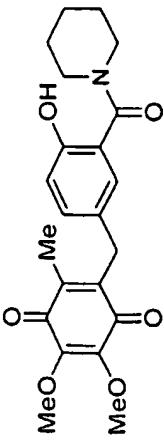
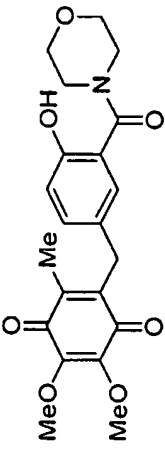
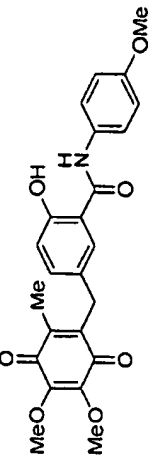
実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
73		赤色結晶 73-75 °C	479 (M ⁺) 154 (100)	1.98 (3H, s), 2.29 (3H, s), 3.78 (2H, s), 3.79 (3H, s), 3.98 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.88 (2H, d, J=8.84 Hz), 7.17-7.21 (2H, m), 7.47 (2H, d, J=8.60 Hz), 7.55 (1H, d, J=7.00 Hz), 7.71 (1H, br s)	3332, 1766, 1648, 1612 (KBr)
74		黄色結晶 131-134 °C	400 (M ⁺ + 1) 69 (100)	1.60-1.72 (6H, m), 2.10 (3H, s), 3.60-3.63 (4H, m), 3.75 (2H, s), 3.98 (6H, s), 6.89 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.07 (1H, d, J=1.80 Hz), 7.14 (1H, dd, J=8.48 and 1.88 Hz), 9.49 (1H, br s)	3198, 1642, 1607 (KBr)
75		黄色結晶 145-146 °C	402 (M ⁺ + 1) 154 (100)	2.11 (3H, s), 3.70-3.74 (10H, m), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.91 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.10-7.17 (2H, m), 9.37 (1H, br s)	3150, 1648, 1611 (KBr)
76		黄色結晶 121-122 °C	438 (M ⁺ + 1) 154 (100)	2.02 (3H, s), 3.66 (2H, s), 3.72 (3H, s), 3.86 (3H, s), 3.87 (3H, s), 6.78-6.82 (3H, m), 7.10 (1H, dd, J=8.40 and 1.68 Hz), 7.33 (2H, d, J=8.88 Hz), 7.38 (1H, d, J=1.44 Hz), 8.22 (1H, br s)	3322, 3076, 1648, 1610 (KBr)

表 25

実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
77		黄色油状物	400 (M ⁺ +1) 154 (100)	1.51-1.71 (6H, m), 2.06 (3H, s), 3.62-3.77 (4H, m), 3.86 (3H, s), 3.98 (2H, s), 3.99 (3H, s), 6.72-6.75 (1H, m), 7.09-7.24 (2H, m), 9.99 (1H, br s)	3300, 1650, 1610 (NaCl)
78		黄色結晶 128-129 °C	402 (M ⁺ +1) 54 (100)	2.07 (3H, s), 3.72 (8H, s), 3.86 (2H, s), 3.98 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.76 (1H, t, J=7.68 Hz), 7.09 (1H, d, J=7.20 Hz), 7.15 (1H, d, J=7.50 Hz), 9.85 (1H, br s)	3692, 1645, 1612 (KBr)
79		黄色結晶 109-110.5 °C	438 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.06 (3H, s), 3.81 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.80 (1H, t, J=7.76 Hz), 6.92 (2H, d, J=7.92 Hz), 7.24 (1H, d, J=8.84 Hz), 7.38 (1H, d, J=7.72 Hz), 7.45 (2H, d, J=8.96 Hz), 7.91 (1H, br s)	3372, 1639, 1610 (KBr)
80		赤黄色油状物	414 (M ⁺ +1, 100)	1.26-1.64 (6H, m), 2.06 (3H, s), 3.12-3.17 (2H, m), 3.71-3.84 (4H, m), 3.78 (3H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.79 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.00 (1H, d, J=2.20 Hz), 7.14 (1H, dd, J=8.50 and 2.24 Hz)	1645, 1610, 1260 (NaCl)

表 26

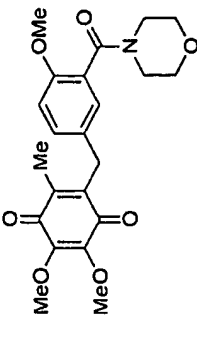
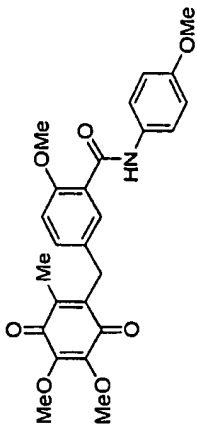
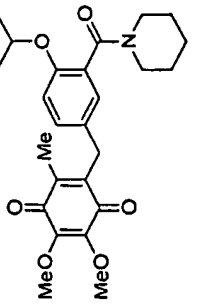
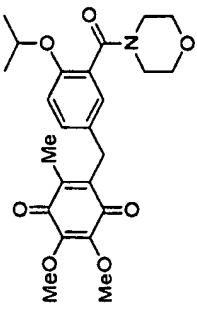
实施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
81		赤黄色油状物	416 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.07 (3H, s), 3.21-3.24 (2H, m), 3.57-3.59 (2H, m), 3.61-3.82 (6H, m), 3.80 (3H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.80 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.04 (1H, d, J=2.12 Hz), 7.17 (1H, dd, J=8.40 and 2.24 Hz)	1644, 1611, 1263 (NaCl)
82		赤黄色油状物	452 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.11 (3H, s), 3.81 (3H, s), 3.85 (2H, s), 3.98 (6H, s), 4.01 (3H, s), 6.88-6.95 (3H, m), 7.32 (1H, dd, J=8.56 and 2.40 Hz), 7.55 (2H, dd, J=6.94 and 2.08 Hz), 8.07 (1H, d, J=2.36 Hz), 9.63 (1H br s)	3356, 1654, 1610, 1512, 1245 (NaCl)
83		赤黄色油状物	442 (M ⁺ +1, 100)	1.26-1.62 (6H, m), 1.60-1.64 (6H, m), 2.06 (3H, s), 3.10-3.19 (2H, m), 3.70-3.82 (4H, m), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.45-4.49 (1H, m), 6.77 (1H, d, J=8.56 Hz), 6.99 (1H, d, J=2.20 Hz), 7.11 (1H, dd, J=8.36 and 2.12 Hz)	1636, 1610, 1265 (NaCl)
84		赤黄色油状物	444 (M ⁺ +1) 154 (100)	1.27-1.33 (6H, m), 2.07 (3H, s), 3.18-3.27 (2H, m), 3.57-3.85 (8H, m), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.47-4.53 (1H, m), 6.78 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.03 (1H, d, J=2.20 Hz), 7.14 (1H, dd, J=8.50 and 2.20 Hz)	3346, 1645, 1611, 1264 (NaCl)

表 27

实施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
85		赤黄色油状物	480 (M ⁺ + 1) 154 (100)	1.48 (6H, d, J=6.04 Hz), 2.11 (3H, s), 3.81 (3H, s), 3.84 (2H, s), 3.99 (6H, s), 4.73-4.79 (1H, m), 6.88-6.93 (3H, m), 7.29 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.57 (2H, d, J=8.96 Hz), 8.07 (1H, d, J=2.36 Hz), 10.05 (1H br s)	1662, 1610, 1511, 1260 (NaCl)
86		黄色油状物	476 (M ⁺ + 1, 100)	1.47-1.62 (6H, m), 2.08 (3H, s), 3.21-3.24 (2H, m), 3.57-3.75 (2H, m), 3.75-3.88 (2H, m), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.76 (1H, d, J=9.12 Hz), 6.97 (2H, d, J=7.92 Hz), 7.07-7.13 (3H, m), 7.27-7.33 (2H, m)	1636, 1612, 1485 (NaCl)
87		黄色油状物	478 (M ⁺ + 1) 154 (100)	2.08 (3H, s), 3.33-3.47 (2H, m), 3.61-3.88 (8H, m), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.79 (1H, d, J=8.28 Hz), 6.95 (2H, d, J=8.12 Hz), 7.10-7.17 (3H, m), 7.30-7.35 (2H, m)	1645, 1610, 1484 (NaCl)
88		黄色油状物	514 (M ⁺ + 1, 100)	2.12 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.87 (2H, s), 3.99 (6H, s), 6.80 (1H, d, J=8.44 Hz), 6.85 (1H, d, J=8.84 Hz), 7.08 (2H, d, J=8.04 Hz), 7.19-7.27 (3H, m), 7.39 (2H, d, J=8.04 Hz), 7.48 (2H, d, J=8.92 Hz), 8.10 (1H, d, J=1.84 Hz), 9.48 (1H, br s)	3374, 1659, 1610, 1512 (NaCl)

表 28

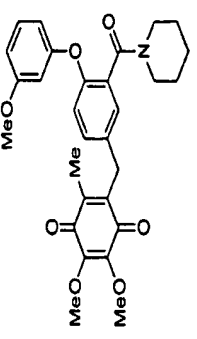
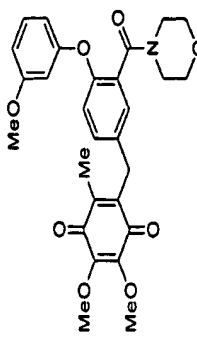
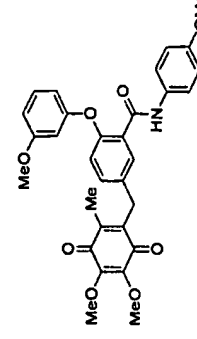
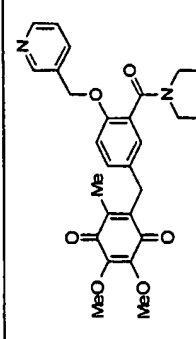
实施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
89		黄色油状物	506 (M ⁺ +1) 54 (100)	1.43-1.63 (6H, m), 2.08 (3H, s), 3.21-3.33 (2H, m), 3.57-3.71 (2H, m), 3.76 (3H, s), 3.71-3.82 (2H, m), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.54-6.56 (2H, m), 6.64 (1H, d, J=7.72 Hz), 6.80 (1H, d, J=5.68 Hz), 7.12-7.14 (2H, m), 7.19 (1H, t, J=7.18 Hz)	1642, 1609, 1484 (NaCl)
90		黄色油状物	507 (M ⁺) 154 (100)	2.09 (3H, s), 3.31-3.39 (2H, m), 3.57-3.84 (8H, m), 3.76 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.52-6.54 (2H, m), 6.65 (1H, dd, J=7.72 and 2.32 Hz), 6.82 (1H, dd, J=5.68 and 3.52 Hz), 7.14-7.23 (3H, m)	1643, 1610, 1485 (NaCl)
91		黄色结晶 128-130 °C	544 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.12 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.79 (3H, s), 3.88 (2H, s), 3.99 (6H, s), 6.62-6.66 (2H, m), 7.75 (1H, d, J=8.40 Hz), 6.82-6.87 (3H, m), 7.24-7.31 (2H, m), 7.48 (2H, d, J=8.88 Hz), 8.09 (1H, d, J=2.12 Hz), 9.42 (1H, br s)	3376, 1684, 1608, 1513 (KBr)
92		黄色油状物	491 (M ⁺ +1) 154 (100)	1.40-1.41 (2H, m), 1.57-1.59 (4H, m), 2.06 (3H, s), 3.13-3.15 (2H, m), 3.68-3.70 (2H, m), 3.71-3.85 (2H, m), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, m), 5.08 (2H, s), 6.85 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.04 (1H, d, J=2.08 Hz), 7.14 (1H, dd, J=8.48 and 2.04 Hz), 7.30-7.32 (1H, m), 7.73 (1H, d, J=7.80 Hz), 8.56 (1H, d, J=3.72 Hz), 8.62 (1H, d, J=1.24 Hz)	1650, 1611, 1266 (NaCl)

表29

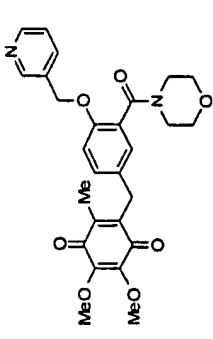
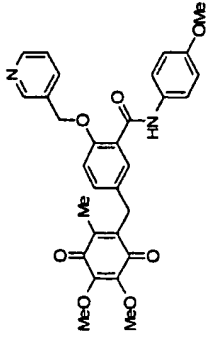
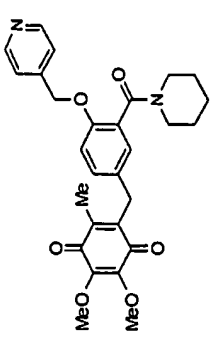
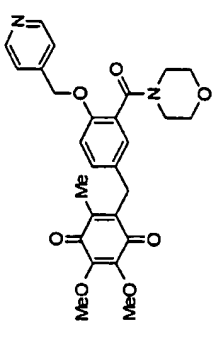
実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
93		黄色油状物	493 (M ⁺ + 1) 154 (100)	2.07 (3H, s), 3.21-3.24 (2H, m), 3.47-3.64 (2H, m), 3.66-3.84 (6H, m), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, m), 5.08 (2H, s), 6.88 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.08 (1H, d, J=2.12 Hz), 7.18 (1H, dd, J=8.52 and 2.20 Hz), 7.30-7.33 (1H, m), 7.73 (1H, d, J=7.88 Hz), 8.58 (1H, dd, J=4.72 and 1.24 Hz), 8.63 (1H, d, J=1.76 Hz)	1644, 1611, 1265 (NaCl)
94		黄色結晶 128-130 °C	529 (M ⁺ + 1) 154 (100)	2.12 (3H, s), 3.77 (3H, s), 3.86 (2H, s), 3.99 (6H, s), 5.23 (2H, s), 6.78 (2H, d, J=8.92 Hz), 7.03 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.23 (2H, dd, J=9.00 Hz), 7.34-7.41 (2H, m), 7.83 (1H, d, J=7.84 Hz), 8.09 (1H, d, J=7.84 Hz), 8.70 (1H, d, J=4.80 Hz), 8.78 (1H, br s), 9.55 (1H, br s)	3357, 1658, 1611, 1513 (KBr)
95		黄色油状物	491 (M ⁺ + 1) 154 (100)	1.42-1.44 (2H, m), 1.60-1.64 (4H, m), 2.07 (3H, s), 3.16-3.20 (2H, m), 3.72-3.74 (2H, m), 3.74-3.85 (2H, m), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 5.07-5.09 (2H, m), 6.78 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.05 (1H, d, J=2.00 Hz), 7.13 (1H, dd, J=8.52 and 2.12 Hz), 7.30 (2H, d, J=5.56 Hz), 8.59 (2H, d, J=5.92 Hz)	1660, 1610, 1265 (NaCl)
96		黄色油状物	493 (M ⁺ + 1) 154 (100)	2.07 (3H, s), 3.25-3.28 (2H, m), 3.53-3.55 (2H, m), 3.70-3.84 (6H, m), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, m), 5.09 (2H, s), 6.80 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.09 (1H, d, J=1.44 Hz), 7.16 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.29 (2H, d, J=6.56 Hz), 8.61 (2H, d, J=5.56 Hz)	1660, 1610, 1265 (NaCl)

表30

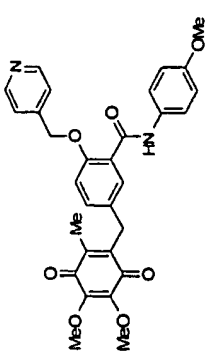
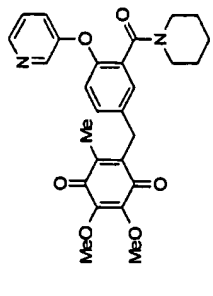
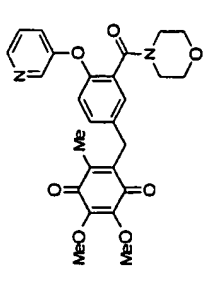
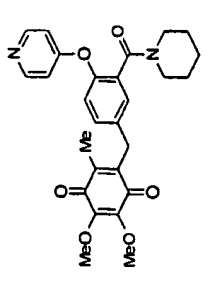
実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
97		黄色結晶 131-134 °C	529 (M ⁺ +1) 69 (100)	2.11 (3H, s), 3.78 (3H, s), 3.86 (2H, s), 3.99 (6H, s), 5.23 (2H, s), 6.82 (2H, d, J=8.92 Hz), 6.94 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.31-7.34 (3H, m), 7.40 (2H, d, J=5.68 Hz), 8.08 (1H, d, J=2.32 Hz), 8.69 (2H, d, J=5.76 Hz), 9.50 (1H, br s)	3374, 1654, 1608, 1512 (KBr)
98		黄色油状物	477 (M ⁺ +1) 52 (100)	1.40-1.62 (6H, m), 2.11 (3H, s), 3.19-3.23 (2H, m), 3.54-3.60 (2H, m), 3.86 (2H, d, J=14.24 Hz), 4.00 (3H, s), 4.01 (3H, s), 6.82 (2H, d, J=6.08 Hz), 6.97 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.18 (1H, d, J=2.04 Hz), 7.24-7.26 (1H, m), 8.44 (2H, d, J=5.36 Hz)	1640, 1611, 1264 (NaCl)
99		黄色油状物	479 (M ⁺ +1) 52 (100)	2.12 (3H, s), 3.25-3.40 (2H, m), 3.60-3.69 (6H, m), 3.85-3.88 (2H, m), 4.00 (3H, s), 4.01 (3H, s), 6.81 (2H, d, J=5.50 Hz), 6.98 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.23 (1H, d, J=2.08 Hz), 7.26-7.30 (1H, m), 8.46 (2H, d, J=5.68 Hz)	1638, 1611, 1263 (NaCl)
100		黄色油状物	477 (M ⁺ +1) 52 (100)	1.50-1.72 (6H, m), 2.09 (3H, s), 3.23-3.29 (2H, m), 3.60-3.65 (2H, m), 3.83 (2H, d, J=14.12 Hz), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.81 (1H, d, J=8.32 Hz), 7.14-7.17 (4H, m), 8.35 (1H, dd, J=5.56 and 2.11 Hz), 8.39 (1H, d, J=1.92 Hz)	1636, 1611, 1264 (NaCl)

表31

实施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
101		黄色油状物	479 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.10 (3H, s), 3.33-3.37 (2H, m), 3.61-3.85 (8H, m), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.82 (1H, d, J=8.24 Hz), 7.19-7.26 (5H, m), 8.37 (1H, d, J=8.08 Hz)	1641, 1611, 1263 (NaCl)
102		黄色結晶 89-92 °C	472 (M ⁺ +1) 154 (100)	1.40-1.60 (6H, m), 2.06 (3H, s), 3.14-3.30 (2H, m), 3.70-3.84 (4H, m), 3.77 (3H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.60-4.63 (2H, m), 6.65 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.04 (1H, d, J=2.12 Hz), 7.12 (1H, d, 8.56 and 2.20 Hz)	1748, 1649, 1630, 1610 (KBr)
103		黄色結晶 141-143 °C	474 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.03 (3H, s), 3.23-3.26 (1H, m), 3.39-3.43 (1H, m), 3.57-3.99 (8H, m), 3.77 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 4.64 (2H, s), 6.64 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.08 (1H, d, J=2.04 Hz), 7.15 (1H, dd, J=8.52 and 2.08 Hz)	1751, 1668, 1634, 1610 (KBr)
104		黄色油状物	514 (M ⁺ +1) 54 (100)	1.45-1.64 (6H, m), 1.47 (9H, s), 2.06 (3H, s), 3.18-3.29 (2H, m), 3.66-3.84 (4H, m), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.43-4.54 (2H, m), 6.63 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.04 (1H, br s), 7.12 (1H, d, J=8.40 Hz)	1748, 1646, 1456, 1264 (NaCl)

表32

実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
105		黄色油状物	516 (M ⁺ +1) 154 (100)	1.47 (9H, s), 2.07 (3H, s), 3.20-3.25 (1H, m), 3.43-3.47 (1H, m), 3.56-3.84 (8H, m), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.50-4.52 (2H, m), 6.62 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.08 (1H, d, J=2.12 Hz), 7.15 (1H, dd, J=8.56 and 2.12 Hz)	1750, 1641, 1611, 1267 (NaCl)
106		黄色油状物	539 (M ⁺ +1) 183 (100)	2.10 (3H, s), 2.32 (3H, s), 3.83 (3H, s), 3.87 (6H, S), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.80-6.90 (2H, m), 7.05 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.33 (1H, dd, J=8.28 and 1.88 Hz), 7.61 (1H, s), 7.94 (1H, br s)	3300, 1766, 1652, 1609 (NaCl)
107		黄色油状物	510 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.11 (3H, s), 2.32 (3H, s), 3.88 (6H, S), 3.91 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.83 (1H, d, J=8.60 Hz), 6.89 (1H, dd, J=8.60 and 2.24 Hz), 7.05 (1H, d, J=8.32 Hz), 7.34 (1H, dd, J=8.32 and 2.04 Hz), 7.46 (1H, d, J=1.96 Hz), 7.64 (1H, d, J=1.56 Hz), 7.92 (1H, br s)	3338, 1766, 1649, 1610 (NaCl)
108		黄色結晶 176-179 °C	492 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.11 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.59 (3H, s), 3.88 (2H, s), 3.99 (6H, S), 7.07 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.36 (1H, dd, J=8.32 and 2.12 Hz), 7.66-7.71 (3H, m), 7.97 (2H, d, J=8.64 Hz), 8.27 (1H, br s)	3322, 1766, 1652, 1594 (NaCl)

表33

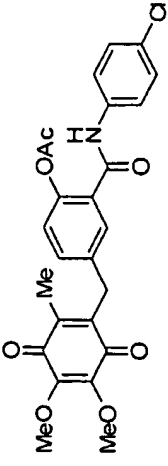
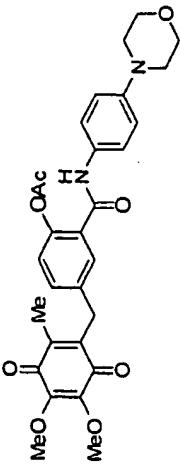
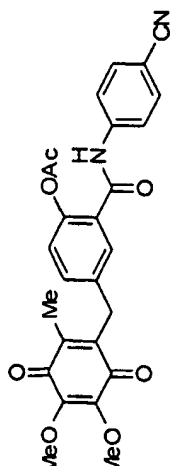
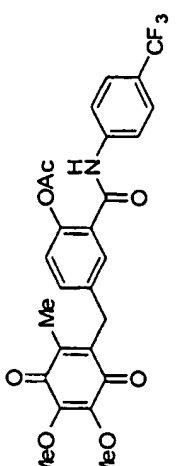
实施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
109		黄色油状物	484 (M ⁺ + 1) 69 (100)	2.09 (3H, s), 2.30 (3H, s), 3.85 (2H, s), 3.98 (6H, s), 7.06 (1H, d, J=8.90 Hz), 7.26-7.34 (3H, m), 7.53 (2H, d, J=8.60 Hz), 7.62 (1H, s), 8.13 (1H, br s)	3320, 1766, 1648, 1610 (NaCl)
110		黄色結晶 173-177 °C	535 (M ⁺ + 1) 154 (100)	2.11 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.10-3.15 (4H, m), 3.84-3.88 (6H, m), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.90 (2H, d, J=8.88 Hz), 7.04 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.32 (1H, dd, J=8.24 and 1.88 Hz), 7.48 (2H, d, J=8.88 Hz), 7.65 (1H, s), 7.89 (1H, br s)	3300, 1766, 1650, 1611 (NaCl)
111		黄色油状物	475 (M ⁺ + 1) 154 (100)	2.11 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.87 (2H, s), 3.99 (6H, s), 7.07 (1H, d, J=8.44 Hz), 7.36 (1H, d, J=8.32 Hz), 7.61-7.66 (3H, m), 7.69-7.76 (2H, m), 8.28 (1H, br s)	3323, 2224, 1767, 1648, 1610 (NaCl)
112		黄色結晶 127-128 °C	518 (M ⁺ + 1) 476 (100)	2.13 (3H, s), 2.32 (3H, s), 3.89 (2H, s), 4.00 (3H, s), 4.01 (3H, s), 7.08 (1H, d, J=8.32 Hz), 7.37 (1H, dd, J=8.32 and 2.20 Hz), 7.62 (2H, d, J=8.60 Hz), 7.66 (1H, s), 7.72 (2H, d, J=8.56 Hz), 8.17 (1H, br s)	3320, 1767, 1648, 1610, 1322 (NaCl)

表34

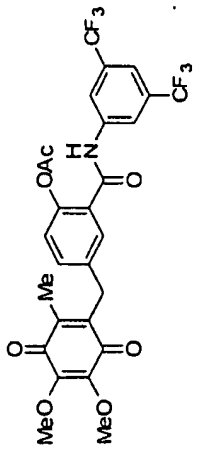
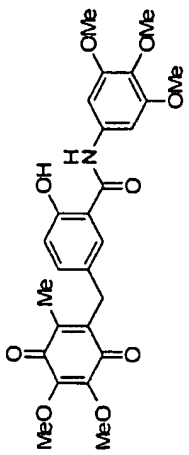
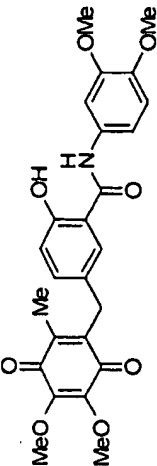
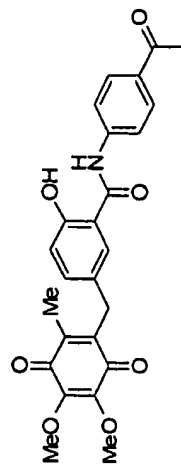
実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
113		黄色結晶 127-129 °C	586 (M ⁺ + 1) 544 (100)	2.12 (3H, s), 2.33 (3H, s), 3.88 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.09 (1H, d, J=8.32 Hz), 7.37 (1H, dd, J=8.36 and 2.12 Hz), 7.60-7.65 (2H, m), 8.10 (2H, d like), 8.35 (1H, br s)	3339, 1768, 1649, 1612, 1382 (NaCl)
114		黄色結晶 68-70 °C	498 (M ⁺ + 1) 183 (100)	2.15 (3H, s), 3.79 (2H, s), 3.85 (3H, s), 3.89 (6H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.87 (1H, s), 6.92 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.20 (1H, d, J=8.28 Hz), 7.27 (1H, s), 7.44 (1H, s), 8.02 (1H, br s), 11.81 (1H, br s)	3300, 1648, 1610 (NaCl)
115		黄色結晶 72-75 °C	468 (M ⁺ + 1) 154 (100)	2.15 (3H, s), 3.79 (2H, s), 3.90 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.86-6.94 (2H, m), 7.00 (1H, dd, J=8.60 and 2.40 Hz), 7.21 (1H, dd, J=8.48 and 1.92 Hz), 7.26-7.27 (1H, m), 7.42 (1H, d, J=1.56 Hz), 7.95 (1H, s), 11.91 (1H, s)	3350, 1647, 1610 (NaCl)
116		黄色結晶 158-160 °C	450 (M ⁺ + 1) 154 (100)	2.16 (3H, s), 2.61 (3H, s), 3.80 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.94 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.24 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.48 (1H, d, J=1.72 Hz), 7.73 (2H, d, J=8.68 Hz), 8.01 (2H, d, J=8.68 Hz), 8.22 (1H, br s), 11.56 (1H, br s)	3326, 1651, 1610 (NaCl)

表 35

实施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
117		黄色結晶 138-141 °C	442 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.13 (3H, s), 3.76 (2H, s), 3.95 (3H, s), 3.96 (3H, s), 6.90 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.20 (1H, dd, J=8.48 and 1.88 Hz), 7.33 (2H, d, J=8.48 Hz), 7.46 (1H, d, J=1.68 Hz), 7.52 (2H, d, J=8.84 Hz), 8.26 (1H, br s), 11.55-11.85 (1H, br)	3250, 1647, 1609 (NaCl)
118		黄色結晶 184-186 °C	493 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.15 (3H, s), 3.15-3.18 (4H, m), 3.79 (2H, s), 3.79-3.89 (4H, m), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.90-6.95 (3H, m), 7.21 (1H, dd, J=8.52 and 1.96 Hz), 7.40-7.47 (3H, m), 7.87 (1H, br s), 11.96 (1H, s)	3250, 1647, 1610 (NaCl)
119		黄色結晶 149-151 °C	433 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.16 (3H, s), 3.79 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.94 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.23-7.26 (1H, m), 7.49 (1H, s), 7.68 (2H, d, J=8.56 Hz), 7.77 (2H, d, J=8.60 Hz), 8.32 (1H, br s), 11.28-11.36 (1H, br)	3326, 2224, 1648, 1610 (NaCl)
120		黄色結晶 169.5-173 °C	476 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.16 (3H, s), 3.80 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.92 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.24 (1H, dd, J=8.60 and 1.96 Hz), 7.48 (1H, d, J=1.56 Hz), 7.65 (2H, d, J=8.60 Hz), 7.74 (2H, d, J=8.56 Hz), 8.21 (1H, br s), 11.56 (1H, s)	3250, 1648, 1610 (NaCl)

表 36

実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
121		黄色結晶 168-171 °C	544 (M ⁺ +1) 154 (100)	2.16 (3H, s), 3.80 (2H, s), 3.97 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.95 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.24-7.27 (1H, m), 7.51 (1H, s), 7.70 (1H, s), 8.14 (2H, s), 8.44 (1H, br s), 11.32 (1H, s)	3250, 1648, 1611, 1381 (NaCl)
122		黄色結晶 54-56 °C	436 (M ⁺ +1) 154 (100)	1.63 (3H, d, J=6.92 Hz), 2.11 (3H, s), 3.75 (2H, s), 3.96 (3H, s), 3.98 (3H, s), 5.20-5.23 (1H, m), 6.48 (1H, d, J=7.36 Hz), 6.87 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.14 (1H, dd, J=8.56 and 1.92 Hz), 7.27-7.39 (6H, m), 12.14 (1H, br s)	3300, 1644, 1610 (NaCl)
123		黄色結晶 53-55 °C	436 (M ⁺ +1) 154 (100)	1.63 (3H, d, J=6.84 Hz), 2.11 (3H, s), 3.75 (2H, s), 3.96 (3H, s), 3.97 (3H, s), 5.22-5.33 (1H, m), 6.50 (1H, d, J=6.64 Hz), 6.87 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.14 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.26-7.39 (6H, m), 12.15 (1H, br s)	3358, 1643, 1611 (NaCl)
124		黄色油状物	524 (M ⁺ +1, 100)	1.54-1.97 (2H, m), 2.05 (3H, s), 2.41-2.75 (2H, br), 3.32-3.64 (1H, br), 3.81 (2H, s), 4.00 (3H, s), 4.01 (3H, s), 4.20-4.59 (1H, br), 6.26-6.89 (6H, m), 6.90-7.10 (4H, m), 7.11-7.26 (2H, m), 7.27-7.33 (1H, br)	1645, 1610, 1486, 1264 (NaCl)

表37

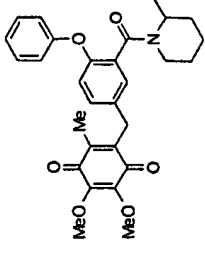
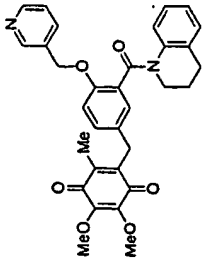
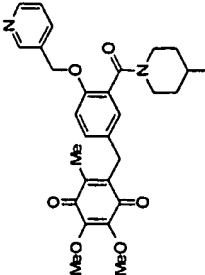
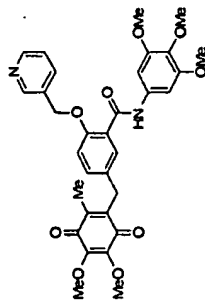
实施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
125		黄色油状物	490 (M ⁺ + 1) 154 (100)	1.03-1.72 (8H, m), 2.07-2.09 (3H, m), 2.77-3.19 (2H, m), 3.35-3.94 (1H, m), 3.74-3.95 (2H, m), 3.90-4.00 (6H, m), 4.54-4.98 (1H, m), 6.72-6.94 (1H, m), 6.97-7.00 (2H, m), 7.04-7.21 (3H, m), 7.26-7.33 (2H, m)	1650, 1612, 1485, 1266 (NaCl)
126		黄色油状物	539 (M ⁺ + 1) 92 (100)	1.70-1.96 (4H, br), 2.02 (3H, s), 2.37-2.68 (1H, br), 3.38-3.56 (1H, br), 3.78 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 4.12-4.52 (1H, br), 4.73-5.03 (1H, br), 6.22-6.51 (1H, br), 6.51-6.81 (2H, br), 6.89-7.08 (2H, br), 7.11 (1H, d, J=8.12 Hz), 7.18 (1H, d, J=2.04 Hz), 7.20-7.27 (1H, m), 7.42-7.60 (1H, br), 8.30-8.48 (1H, br), 8.56 (1H, d, J=4.12 Hz)	1648, 1610, 1492, 1265 (NaCl)
127		黄色油状物	505 (M ⁺ + 1) 219 (100)	0.72-1.99 (8H, m), 2.07 (3H, s), 2.63-2.95 (2H, m), 3.39-3.43 (1H, m), 3.70-3.85 (2H, m), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 4.60-4.71 (1H, m), 5.07 (2H, s), 6.80-6.89 (1H, m), 7.01-7.07 (1H, m), 7.13-7.17 (1H, m), 7.28-7.33 (1H, m), 7.69-7.79 (1H, m), 8.50-8.64 (2H, m)	1650, 1612, 1451, 1265 (NaCl)
128		黄色結晶 130-132 °C	589 (M ⁺ + 1) 154 (100)	2.12 (3H, s), 3.74 (3H, s), 3.79 (3H, s), 3.88 (3H, s), 4.00 (6H, s), 5.22 (2H, s), 6.62 (2H, s), 7.07 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.36-7.42 (2H, m), 7.38-7.44 (2H, m), 7.86 (1H, d, J=7.80 Hz), 8.11 (1H, d, J=2.20 Hz), 8.68 (1H, dd, J=4.68 and 1.16 Hz), 8.84 (1H, d, J=1.52 Hz), 9.63 (1H, br s)	3356, 1654, 1608, 1508 (NaCl)

表38

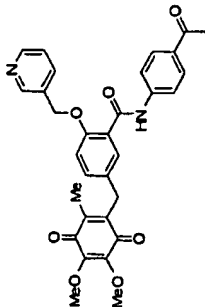
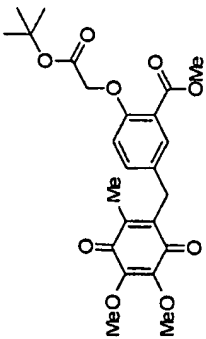
実施例 番号	構造	性状	FABMS(m/z)	NMR(CDCl ₃ , δ)	IR (cm ⁻¹)
129		黄色結晶 152-155 °C	541 (M ⁺ + 1) 92 (100)	2.13 (3H, s), 3.55 (3H, s), 3.88 (2H, s), 4.00 (6H, s), 5.24 (2H, s), 7.06 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.32 (2H, d, J=8.68 Hz), 7.38-7.44 (2H, m), 7.83-7.86 (3H, m), 8.10 (1H, d, J=2.20 Hz), 8.45 (1H, dd, J=4.64 and 1.28 Hz), 8.81 (1H, d, J=1.64 Hz), 9.90 (1H, br s)	3340, 1673, 1609, 1530 (NaCl)
130		黄色油状物	461 (M ⁺ + 1) 405 (100)	1.47 (9H, s), 2.08 (3H, s), 3.79 (2H, s), 3.89 (3H, s), 3.99 (6H, s), 4.56 (2H, s), 6.75 (1H, d, J=8.60 Hz), 7.25 (1H, dd, J=8.64 and 1.64 Hz), 7.61 (1H, d, J=1.56 Hz)	1731, 1648, 1611, 1264 (NaCl)

表 39

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
131		橙色結晶	200.2-201.9	3334, 1684, 1652, 1612, 1552, 1497, 1265 (KBr)	2.08 (3H, s), 3.85 (2H, s), 4.00 (6H, s), 6.79 (1H, s), 6.80 (1H, s), 7.37 (1H, d, J=8.70 Hz), 7.44 (1H, d, J=8.7 Hz), 7.96 (1H, s), 8.17 (1H, dd, J=8.7, 2.8 Hz), 8.47 (1H, d, J=2.7 Hz), 11.78 (1H, s)	443 (M+ +1)
132		橙色結晶	113.5-115.1	1782, 1649, 1611, 1586, 1521, 1389, 1268 (KBr)	2.11(3H, s), 2.40 (3H, s), 3.91 (2H, s), 4.00 (6H, s), 6.82 (1H, s), 7.03 (1H, s), 7.90 (1H, d, J=8.2 Hz), 8.17-8.18 (1H, m), 8.78-8.79 (1H, m), 8.92 (1H, dd, J=8.2, 1.6 Hz)	485 (M+ +1)
133		橙色結晶	200.2-202.6	3280, 1649, 1611, 1586, 1534, 1432, 1267 (KBr)	2.09 (3H, s), 3.87 (2H, s), 4.01 (6H, s), 6.82 (1H, s), 6.84 (1H, s), 7.33-7.34 (1H, m), 7.47 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.19 (1H, d, J=4.7 Hz), 8.50 (1H, s), 8.78 (1H, d, J=8.2 Hz), 11.77 (1H, s)	443 (M+ +1)
134		橙色結晶	124.7-125.5	1768, 1654, 1611, 1529, 1500, 1269 (KBr)	2.03 (3H, s), 2.26 (3H, s), 3.82 (2H, s), 3.87 (3H, s), 3.93 (6H, s), 6.70-6.71 (1H, m), 6.92 (1H, s), 7.12 (1H, d, J=7.9 Hz), 7.68-7.69 (1H, m), 7.82-7.83 (1H, m), 7.84-7.85 (1H, m), 8.13 (1H, s)	481 (M+ +1)

表 40

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
135		橙色結晶	194.3-196.5	3335, 1651, 1612, 1552, 1497, 1266 (KBr)	2.08 (3H, s), 3.85 (2H, s), 3.96 (3H, s), 4.00 (3H, s), 4.01 (3H, s), 6.73-6.82 (3H, m), 7.48 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.91-8.00 (2H, m), 8.28 (1H, s), 11.91 (1H, br s)	439 (M+ +1)
136		橙色アモルファス		1773, 1652, 1612, 1588, 1526, 1365, 1267, 1217 (KBr)	2.11 (3H, s), 2.34 (3H, s), 3.91 (2H, s), 4.00 (6H, s), 7.02 (1H, s), 7.22 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.76 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.91 (2H, d, J=8.9 Hz), 8.02 (2H, d, J=8.8 Hz), 8.37 (1H, s)	582 (M+ +1)
137		橙色結晶	186.9-187.5	3138, 1679, 1652, 1612, 1438, 1341, 1292, 1264 (KBr)	2.09 (3H, s), 3.86 (2H, s), 4.00 (3H, s), 4.01 (3H, s), 6.81 (1H, d, J=8.8 Hz), 6.82 (1H, s), 7.46 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.93 (2H, d, J=8.8 Hz), 8.05 (2H, d, J=8.8 Hz), 8.23 (1H, s), 11.35 (1H, s)	540 (M+ +1)
138		橙色結晶	158.2-160.0	1769, 1654, 1611, 1530, 1500, 1272, 1206 (KBr)	2.07 (3H, s), 2.34 (3H, s), 3.85 (2H, s), 4.00 (3H, s), 4.01 (3H, s), 6.78-6.80 (1H, m), 6.80 (1H, s), 7.38-7.40 (1H, m), 7.59 (1H, d, J=8.2 Hz), 8.29-8.31 (1H, m), 8.32-8.39 (2H, m), 8.78 (1H, s)	451 (M+ +1)

表 41

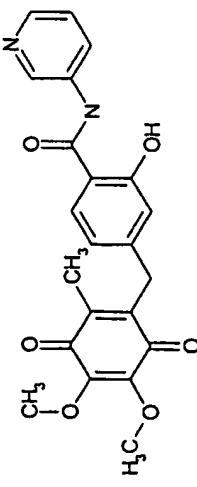
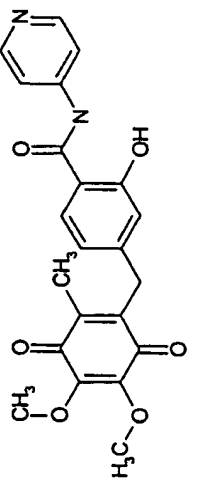
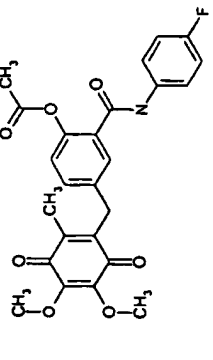
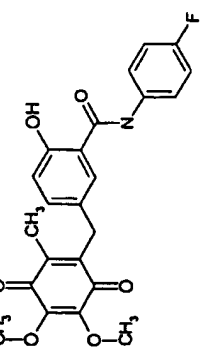
実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
139		橙色結晶	138.1-139.7	3297, 1648, 1611, 1544, 1430, 1267 (KBr)	2.07 (3H, s), 3.88 (2H, s), 4.00 (3H, s), 4.01 (3H, s), 6.80 (1H, s), 6.84 (1H, d, J=8.4 Hz), 7.63-7.70 (1H, m), 8.10 (1H, d, J=8.3 Hz), 8.35-8.38 (1H, m), 9.00 (1H, d, J=9.3 Hz), 9.49 (1H, s), 9.99 (1H, s), 11.58-11.80 (1H, br s)	409 (M ⁺ +1)
140		橙色結晶	181.4-183.3	3298, 1648, 1611, 1542, 1430, 1266 (KBr)	2.11 (3H, s), 3.97 (2H, s), 4.01 (3H, s), 4.02 (3H, s), 7.19-7.21 (2H, m), 7.60-7.71 (2H, m), 8.09-8.11 (2H, m), 8.87-8.90 (2H, m), 10.78-11.31 (1H, br s)	409 (M ⁺ +1)
141		黄色結晶	128.5-130.5	1751, 1651, 1611, 1515, 1268 (KBr)	2.11 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.87 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.03-7.08 (3H, m), 7.25-7.56 (2H, m), 7.34 (1H, dd, J=8.32, 2.16 Hz), 7.64-7.65 (1H, m), 7.96 (1H, br s)	468 (M ⁺ +1), 154 (100)
142		黄色結晶	125-127	3359, 1648, 1615, 1511, 1266 (KBr)	2.15 (3H, s), 3.79 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 7.08 (1H, d, J=2.08 Hz), 7.10-7.13 (2H, m), 7.22 (1H, dd, J=8.56 and 1.84 Hz), 7.43 (1H, d, J=1.64 Hz), 7.51-7.55 (2H, m), 7.93 (1H, br s), 11.75 (1H, s)	426 (M ⁺ +1), 100

表 42

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
143		黄色結晶	152-153.5	1764, 1654, 1612, 1530, 1268 (KBr)	2.12 (3H, s), 2.34 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.09 (1H, d, J=8.32 Hz), 7.38 (1H, dd, J=8.28, 2.04 Hz), 7.54 (1H, t, J=8.16 Hz), 7.66 (1H, d, J=1.72 Hz), 7.98-8.02 (2H, m), 8.26- 8.27 (1H, m), 8.45 (1H br s)	495 (M ⁺ +1), 154 (100)
144		黄色結晶	153-154	3337, 1642, 1610, 1549, 1530, 1271 (KBr)	2.16 (3H, s), 3.81 (2H, s), 3.96 (3H, s), 3.98 (3H, s), 7.09 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.24-7.27 (1H, m), 7.52 (1H, d, J=1.68 Hz), 7.57 (1H, t, J=8.24 Hz), 8.00-8.06 (2H, m), 8.36 (1H br s), 8.44-8.45 (1H, m), 11.46 (1H, s)	453 (M ⁺ +1), 154 (100)
145		黄色結晶	57.5-60	1768, 1660, 1610, 1548, 1337, 1268 (KBr)	2.12 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.09 (1H, d, J=8.32 Hz), 7.26-7.29 (1H, m), 7.40 (1H, m), 7.58-7.71 (3H, m), 8.30-8.32 (1H, m), 8.39 (1H br s)	518 (M ⁺ +1), 476 (100)
146		黄色結晶	111-114	3056, 1653, 1610, 1555, 1336, 1270 (KBr)	2.15 (3H, s), 3.80 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.94 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.23-7.26 (1H, m), 7.46-7.55 (3H, m), 7.80 (1H, d, J=7.88 Hz), 7.88-7.89 (1H, m), 8.12 1H br s), 11.57 (1H, s)	476 (M ⁺ +1), 100

表 43

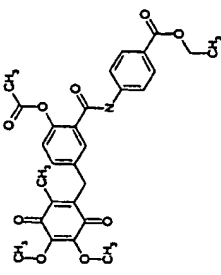
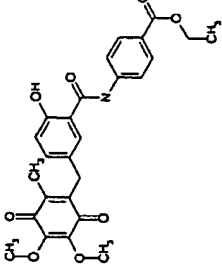
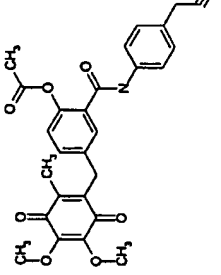
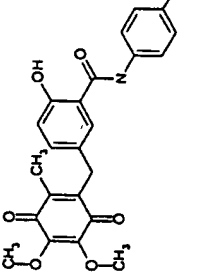
実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
147		黄色結晶	154-156.5	1749, 1713, 1652, 1609, 1278, 1203 (KBr)	1.40 (3H, t, J=7.08 Hz), 2.12 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.88 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.37 (2H, q, J=14.24, 7.08 Hz), 7.07 (1H, d, J=8.32 Hz), 7.36 (1H, dd, J=8.40, 2.08 Hz), 7.65-7.68 (3H, m), 8.05 (2H, d, J=8.60 Hz), 8.19 (1H, br s)	522 (M ⁺ +1), 120 (100)
148		黄色結晶	176-179	3351, 1702, 1648, 1608, 1534, 1285, (KBr)	1.41 (3H, t, J=7.12 Hz), 2.15 (3H, s), 3.79 (2H, s), 3.97 (3H, s), 3.98 (3H, s), 4.39 (2H, q, J=14.24, 7.12 Hz), 6.93 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.22-7.26 (1H, m), 7.47 (1H, d, J=1.44 Hz), 7.69 (2H, d, J=8.64 Hz), 8.08 (2H, d, J=8.64 Hz), 8.17 (1H, br s), 11.58 (1H, s)	480 (M ⁺ +1), 154 (100)
149		黄色結晶	125-128	2946, 1762, 1656, 1612, 1518, 1268, 1206 (KBr)	2.11 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.74 (2H, s), 3.88 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.06 (1H, d, J=8.32 Hz), 7.31-7.36 (3H, m), 7.60-7.65 (3H, m), 8.05 (1H, br s)	489 (M ⁺ +1), 154 (100)
150		黄色結晶	164.5-166	3380, 2950, 1648, 1611, 1538, 1518, 1265, (KBr)	2.15 (3H, s), 3.77 (2H, s), 3.80 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.93 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.23 (1H, dd, J=8.60, 1.88 Hz), 7.36 (2H, d, J=8.40 Hz), 7.44 (1H, d, J=1.64 Hz), 7.61 (2H, d, J=8.44 Hz), 8.03 (1H, br s), 11.70 (1H, s)	447 (M ⁺ +1), 154 (100)

表 44

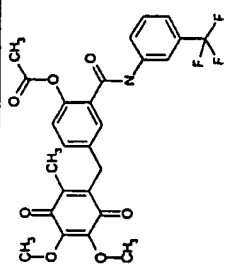
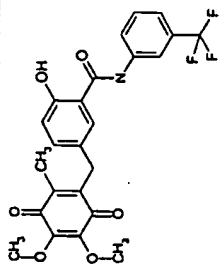
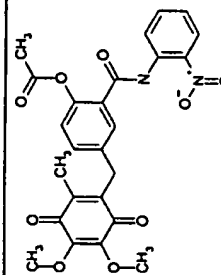
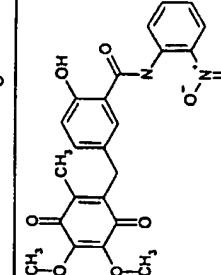
実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
151		黄色結晶	98-100	1757, 1654, 1612, 1529, 1322, 1271 (KBr)	2.12 (3H, s), 2.32 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.09 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.26-7.30 (1H, m), 7.40 (1H, dd, J=8.40, 2.20 Hz), 7.58-7.66 (2H, m), 7.70-7.71 (1H, m), 8.30-8.32 (1H, m), 8.39 (1H br s)	518 (M ⁺ +1), 476 (100)
152		黄色結晶	127.5-130	3310, 1655, 1612, 1540, 1332, 1271 (KBr)	2.14 (3H, s), 3.82 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.97 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.27-7.35 (3H, m), 7.63 (1H, t, J=8.04 Hz), 7.69 (1H, d, J=7.84 Hz), 8.25-8.29 (2H, m), 11.53 (1H, s)	476 (M ⁺ +1, 100)
153		黄色結晶	97.5-100	1780, 1666, 1613, 1500, 1341, 1265 (KBr)	2.13 (3H, s), 2.33 (3H, s), 3.91 (2H, s), 4.00 (3H, s), 4.01 (3H, s), 7.12 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.21-7.25 (1H, m), 7.42 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.67-7.73 (2H, m), 8.23 (1H, d, J=8.36 Hz), 8.87 (1H, d, J=8.90 Hz), 11.04 (1H br s)	495 (M ⁺ +1), 154 (100)
154		黄色結晶	155-156	3334, 1654, 1612, 1502, 1349, 1269 (KBr)	2.14 (3H, s), 3.86 (2H, s), 4.01 (3H, s), 4.02 (3H, s), 6.98 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.24-7.42 (3H, m), 7.72 (1H, t, J=7.90 Hz), 8.28 (1H, dd, J=8.52, 1.40 Hz), 8.86 (1H, d, J=7.88 Hz), 11.94 (1H br s), 11.59 (1H, s)	453 (M ⁺ +1), 154 (100)

表 45

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
155		黄色結晶	124-126.5	1764, 1655, 1612, 1436, 1267, 1204 (KBr)	2.12 (3H, s), 2.39 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.05-7.11 (2H, m), 7.38 (1H, d, J=8.28 Hz), 7.71-7.80 (2H, m), 8.27-8.32 (2H, m), 8.95 (1H br s)	451 (M ⁺ +1, 100)
156		黄色結晶	180-183	3281, 1683, 1665, 1610, 1439, 1309, 1264 (KBr)	2.13 (3H, s), 3.80 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.91 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.11-7.15 (1H, m), 7.21-7.26 (1H, m), 7.56-7.57 (1H, m), 7.77-7.80 (1H, m), 8.32-8.34 (2H, m), 9.07-9.08 (1H, m), 11.99 (1H br s)	409 (M ⁺ +1, 100)
157		黄色結晶	171-172.5	3446, 1650, 1611, 1510, 1266, 1206 (KBr)	2.15 (3H, s), 3.79 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.94 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.22-7.26 (1H, m), 7.58 (1H, s like), 7.64 (2H, dd, J=4.88, 1.44 Hz), 8.56 (2H, dd, J=4.80, 1.44 Hz), 8.78 (1H br s)	409 (M ⁺ +1, 154 (100)
158		黄色結晶	119-122.5	3430, 1651, 1611, 1547, 126, 1206 (KBr)	2.14 (3H, s), 3.79 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.94 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.22-7.26 (1H, m), 7.34-7.38 (1H, m), 7.56 (1H, d, J=1.80 Hz), 8.20-8.22 (1H, m), 8.41-8.43 (1H, m), 8.64 (1H br s), 8.69 (1H, d, J=2.40 Hz)	409 (M ⁺ +1, 154 (100)

表 46

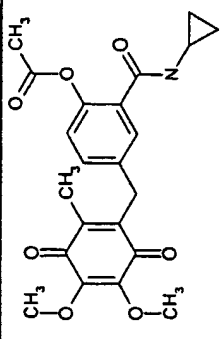
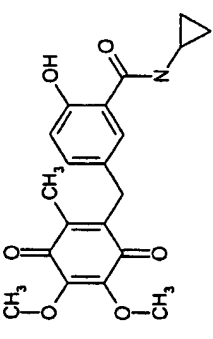
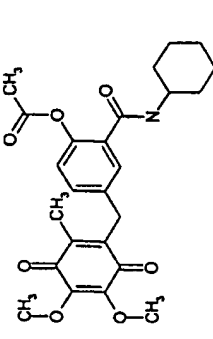
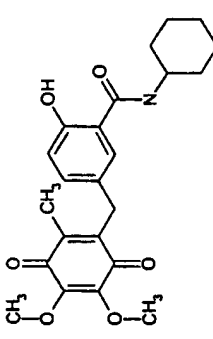
実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
159		黄色結晶	95.5-98	1759, 1642, 1611, 1264, 1208 (KBr)	0.53-0.57 (2H, m), 0.83-0.89 (2H, m), 2.09 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.83-2.87 (1H, m), 3.84 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.28-6.29 (1H, m), 6.98 (1H, d, J=8.32 Hz), 7.26-7.28 (1H, m), 7.51-7.52 (1H, m)	414 (M ⁺ +1), 154 (100)
160		黄色結晶	111-112	3365, 1642, 1611, 1536, 1268 (KBr)	0.65-0.69 (2H, m), 0.88-0.93 (2H, m), 2.12 (3H, s), 2.83-2.87 (1H, m), 3.73 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.40-6.42 (1H, m), 6.87 (1H, d, J=9.04 Hz), 7.14-7.17 (2H, m), 12.20 (1H, s)	372 (M ⁺ +1), 154 (100)
161		黄色結晶	137.5-140	1766, 1638, 1610, 1534, 1265, 1218 (KBr)	1.31-1.46 (5H, m), 1.55-1.75 (3H, m), 1.98-2.01 (2H, m), 2.09 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.84 (2H, s), 3.80-3.95 (1H, m), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.07-6.10 (1H, m), 6.98 (1H, d, J=8.32 Hz), 7.25-7.27 (1H, m), 7.53 (1H, d, J=2.00 Hz)	456 (M ⁺ +1), 154 (100)
162		黄色結晶	107-109	3372, 1644, 1615, 1543, 1265 (KBr)	1.20-1.48 (5H, m), 1.66-1.82 (3H, m), 2.00-2.04 (2H, m), 2.13 (3H, s), 3.75 (2H, s), 3.93-3.97 (1H, m), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.08-6.10 (1H, m), 6.86 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.13 (1H, dd, J=8.52, 1.92 Hz), 7.20 (1H, d, J=1.76 Hz), 12.30 (1H, s)	414 (M ⁺ +1), 154 (100)

表 47

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
163		黄色油状物		1766, 1646, 1610, 1511, 1249 (NaCl)	1.85 (3H, s), 2.30 (3H, s), 3.39 (3H, s like), 3.59 (2H, s), 3.71 (3H, s like), 3.99 (3H, s), 4.01 (3H, s), 6.63-6.74 (3H, m), 6.91-7.08 (4H, m)	494 (M ⁺ +1), 154 (100)
164		黄色油状物		3350, 1647, 1610, 1510, 1248 (NaCl)	1.76 (3H, s), 3.38-3.40 (5H, m), 3.77 (3H, s), 3.98 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.50 (1H, d, J=1.76 Hz), 6.74 (2H, d, J=8.88 Hz), 6.84 (1H, d, J=8.44 Hz), 6.95 (2H, d, J=8.84 Hz), 7.04 (1H, dd, J=8.48, 2.12 Hz), 10.68 (1H, s)	452 (M ⁺ +1), 154 (100)
165		黄色結晶	163-166	1764, 1667, 1614, 1533, 1319 (KBr)	2.00 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.79 (2H, s), 4.00 (3H, s), 4.01 (3H, s), 7.21-7.29 (2H, m), 7.56-7.63 (3H, m), 7.71 (2H, d, J=8.52 Hz), 7.87 (1H br s)	518 (M ⁺ +1), 154 (100)
166		黄色結晶	129-131.5	3384, 1640, 1608, 1537, 1336 (KBr)	2.10 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.86 (1H, t, J=7.76 Hz), 7.29-7.31 (1H, m), 7.48 (1H, d, J=7.64 Hz), 7.65 (2H, d, J=8.60 Hz), 7.74 (2H, d, J=8.52 Hz), 8.32 (1H br s), 11.93 (1H, s)	476 (M ⁺ +1), 154 (100)

表 48

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
167		黄色結晶	83-85.5	1710, 1654, 1610, 1537, 1277 (KBr)	1.38 (3H, t, J=7.08 Hz), 2.12 (3H, s), 3.87 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 4.32-4.37 (2H, m), 5.24 (2H, s), 7.06 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.30 (2H, d, J=8.60 Hz), 7.38-7.43 (2H, m), 7.84-7.93 (3H, m), 8.10 (1H, d, J=1.56 Hz), 8.74-8.80 (2H, m), 9.87 (1H, br s)	571 (M ⁺ +1), 154 (100)
168		黄色結晶	116-119	1677, 1648, 1610, 1590, 1517, 1264 (KBr)	2.13 (3H, s), 3.87 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 5.24 (2H, s), 7.07 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.14 (2H, d, J=5.16 Hz), 7.40-7.45 (2H, m), 7.83-7.86 (1H, m), 8.08 (1H, s like), 8.40 (2H, d, J=5.32 Hz), 8.76 (1H, d, J=4.72 Hz), 8.81 (1H br s), 9.82 (1H br s)	500 (M ⁺ +1), 154 (100)
169		黄色結晶	135-137	1672, 1608, 1543, 1425, 1264 (KBr)	2.12 (3H, s), 3.88 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 5.25 (2H, s), 7.06 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.20-7.24 (1H, m), 7.38- 7.45 (2H, m), 7.85 (1H, d, J=7.76 Hz), 8.09-8.11 (3H, m), 8.29 (1H, d, J=4.52 Hz), 8.73-8.79 (2H m), 9.75 (1H, br s)	500 (M ⁺ +1), 154 (100)
170		黄色結晶	87-89.5	1651, 1610, 1498, 1264 (KBr)	0.27-0.29 (2H, m), 0.71-0.73 (2H, m), 2.10 (3H, s), 2.84-2.87 (1H, m), 3.83 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 5.13 (2H, s), 6.94 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.26- 7.40 (2H, m), 7.70-7.76 (2H, m), 8.00 (1H, s like), 8.67-8.69 (2H, m)	463 (M ⁺ +1), 154 (100)

表 49

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
171		黄色結晶	115-118	2933, 1630, 1610, 1289 (KBr)	0.94-1.47 (8H, m), 1.77-1.80 (2H, m), 2.10 (3H, s), 3.84 (2H, s), 3.84-3.98 (1H, m), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 5.13 (2H, s), 6.96 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.26-7.39 (2H, m), 7.58-7.60 (1H, m), 7.78 (1H, d, J=7.76 Hz), 8.00 (1H, d, J=2.32 Hz), 8.66-8.73 (2H, m)	505 (M ⁺ +1, 100)
172		黄色結晶	173-176	1676, 1610, 1541, 1324, 1265 (KBr)	2.13 (3H, s), 3.88 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 5.24 (2H, s), 7.06 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.34-7.49 (6H, m), 7.82-7.85 (1H, m), 8.10 (1H, d, J=2.36 Hz), 8.74-8.81 (2H, m), 9.85 (1H, br s)	567 (M ⁺ +1, 100) 154 (100)
173		黄色結晶	84.5-87	1770, 1652, 1612, 1588, 1525, 1217 (KBr)	2.13 (3H, s), 2.33 (3H, s), 3.88 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.09 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.39 (1H, dd, J=8.40, 2.16 Hz), 7.65 (1H, d, J=2.16 Hz), 7.90 (2H, d, J=8.92 Hz), 8.02 (2H, d, J=8.76 Hz), 8.42 (1H, br s)	582 (M ⁺ +1, 100) 540 (100)
174		黄色結晶	223-225.5	3325, 1656, 1613, 1584, 1537, 1211 (KBr)	2.17 (3H, s), 3.80 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.95-6.97 (1H, m), 7.50-7.52 (1H, m), 7.97 (2H, d, J=8.52 Hz), 8.06 (2H, d, J=8.76 Hz), 8.40-8.42 (1H, m), 11.00 (1H, br s)	540 (M ⁺ +1, 100) 154 (100)

表 50

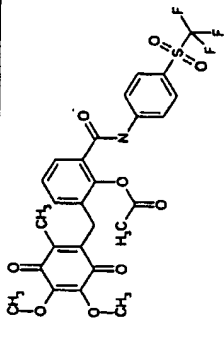
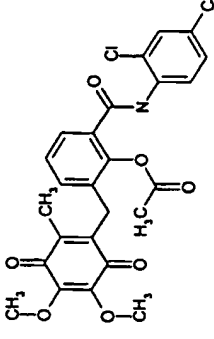
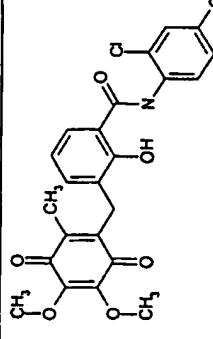
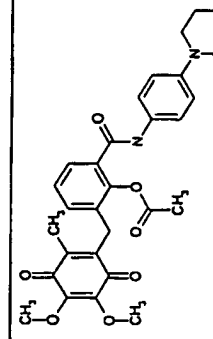
実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
175		黄色結晶	87-89	1770, 1653, 1612, 1589, 1365, 1216 (KBr)	2.01 (3H, s), 2.33 (3H, s), 3.80 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.02 (3H, s), 7.24-7.30 (2H, m), 7.58 (1H, d, J=7.36 Hz), 7.90 (2H, d, J=8.88 Hz), 8.01 (2H, d, J=8.76 Hz), 8.19 (1H, br s)	582 (M ⁺ +1), 154 (100)
176		黄色油状物		1769, 1651, 1610, 1507, 1269, 1194 (KBr)	2.01 (3H, s), 2.35 (3H, s), 3.80 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.21-7.31 (3H, m), 7.42 (1H, d, J=2.36 Hz), 7.65 (1H, d, J=7.56 Hz), 8.29 (1H, br s), 8.48 (1H, d, J=8.92 Hz)	519 (M ⁺ +1), 154 (100)
177		黄色結晶	147-150	3422, 1651, 1610, 1590, 1529, 1269 (KBr)	2.09 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.87 (1H, t, J=7.76 Hz), 7.29-7.33 (2H, m), 7.45-7.48 (2H, m), 8.39 (1H, d, J=8.88 Hz), 8.66 (1H, br s), 12.00 (1H, s)	477 (M ⁺ +1), 154 (100)
178		黄色結晶	168-171	1762, 1650, 1612, 1451, 1269 (KBr)	2.00 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.12-3.15 (4H, m), 3.78 (2H, s), 3.85-3.88 (4H, m), 4.00 (3H, s), 4.01 (3H, s), 6.89-6.92 (2H, m), 7.19-7.25 (2H, m), 7.46-7.49 (2H, m), 7.56-7.60 (2H, m)	534 (M ⁺), 154 (100)

表 51

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
179		黄色結晶	177.5-180.5	3422, 1648, 1611, 1518, 1266 (KBr)	2.07 (3H, s), 3.14-3.17 (4H, m), 3.85-3.89 (6H, m), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.81 (1H, t, J=7.84 Hz), 6.93 (1H, d, J=8.96 Hz), 7.24-7.26 (1H, m), 7.38 (1H, d, J=7.88 Hz), 7.44 (2H, d, J=8.92 Hz), 7.89 (1H, br s), 12.44 (1H, s)	492 (M ⁺), 154 (100)
180		黄色結晶	104.5-107.5	1761, 1654, 1612, 1495, 1286, 1205 (KBr)	2.11 (3H, s), 2.32 (3H, s), 3.87 (2H, s), 3.93 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.77 (1H, d, J=8.80 Hz), 7.06 (1H, d, J=8.32 Hz), 7.34 (1H, dd, J=8.32, 1.96 Hz), 7.66 (1H, br s), 7.95-8.03 (2H, m), 8.20 (1H, d, J=2.40 Hz)	481 (M ⁺ +1), 154 (100)
181		黄色結晶	169-170	3134, 1639, 1608, 1492, 1267 (KBr)	2.14 (3H, s), 3.78 (2H, s), 3.95 (3H, s), 3.97 (3H, s), 3.98 (3H, s), 6.79 (1H, d, J=8.84 Hz), 6.92 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.22 (1H, dd, J=8.56, 1.72 Hz), 7.46 (1H, d, J=1.32 Hz), 7.87 (1H, dd, J=8.80, 2.64 Hz), 8.06 (1H, s like), 8.23 (1H, d, J=2.60 Hz), 11.77 (1H, s)	439 (M ⁺ +1), 154 (100)
182		黄色油状物		1773, 1663, 1610, 1522, 1265 (KBr)	2.12 (3H, s), 2.38 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.91 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 4.03 (3H, s), 6.35 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.08 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.35 (1H, dd, J=8.36, 2.24 Hz), 7.81 (1H, d, J=2.04 Hz), 8.60 (1H, br s), 8.66 (1H, d, J=8.56 Hz)	510 (M ⁺), 154 (100)

表 52

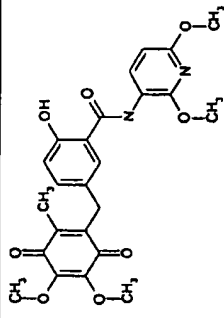
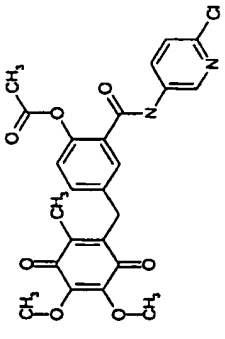
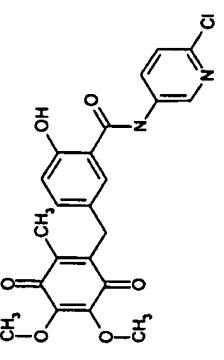
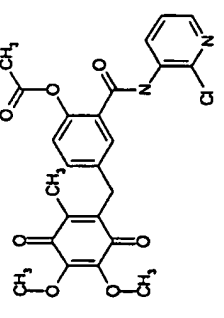
実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
183		黄色結晶	119-121.5	3234, 1651, 1611, 1563, 1265 (KBr)	2.17 (3H, s), 3.82 (2H, s), 3.92 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 4.07 (3H, s), 6.36 (1H, d, J=8.52 Hz), 6.92 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.24 (1H, d, J=1.60 Hz), 7.34 (1H, br s), 8.20 (1H, br s), 8.46 (1H, br s), 11.85 (1H, s)	469 (M++1), 154 (100)
184		黄色結晶	74.5-77.5	1768, 1649, 1611, 1525, 1464, 1203 (KBr)	2.12 (3H, s), 2.33 (3H, s), 3.88 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.08 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.33-7.38 (2H, m), 7.66 (1H, br s), 8.14-8.26 (2H, m), 8.41 (1H, br s)	485 (M++1), 154 (100)
185		黄色結晶	166-169	3451, 1651, 1611, 1537, 1464, 1268 (KBr)	2.16 (3H, s), 3.80 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.94 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.24-7.26 (1H, m), 7.38 (1H, d, J=8.64 Hz), 7.48 (1H, br s), 8.12-8.18 (2H, m), 8.52 (1H, br s), 11.40 (1H, br s)	443 (M++1), 154 (100)
186		黄色結晶	128.5-130	1770, 1669, 1609, 1517, 1273, 1201 (KBr)	2.13 (3H, s), 2.39 (3H, s), 3.90 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.11 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.26-7.40 (1H, m), 7.42 (1H, d, J=2.12 Hz), 7.79 (1H, d, J=2.04 Hz), 8.14-8.16 (1H, m), 8.81 (1H, br s), 8.91 (1H, dd, J=8.16, 1.36 Hz)	485 (M++1), 154 (100)

表 53

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
187		黄色結晶	152-154	3280, 1652, 1612, 1534, 1502, 1267, 1209 (KBr)	2.15 (3H, s), 3.83 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.96 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.31-7.35 (2H, m), 7.43 (1H, s like), 8.19 (1H, dd, J=4.56, 1.44 Hz), 8.60 (1H, br s), 8.80 (1H, dd, J=8.16, 1.48 Hz), 11.33 (1H, br s)	443 (M++1), 154 (100)
188		黄色結晶	78.5-81	1769, 1709, 1651, 1611, 1529, 1294, 1164 (KBr)	1.60 (9H, s), 2.12 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.88 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.07 (1H, d, J=8.32 Hz), 7.35 (1H, dd, J=8.40, 2.08 Hz), 7.63-7.67 (3H, m), 7.99 (2H, d, J=8.60 Hz), 8.16 (1H, br s)	550 (M++1), 154 (100)
189		黄色結晶	199-201.5	3256, 1749, 1720, 1653, 1608, 1533, 1270, 1202 (KBr)	2.12 (3H, s), 2.33 (3H, s), 3.88 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.08 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.36 (1H, dd, J=8.52, 1.64 Hz), 7.66-7.72 (3H, m), 8.11 (2H, d, J=8.20 Hz), 8.28 (1H, br s)	494 (M++1), 154 (100)
190		黄色結晶	257-260	3139, 1700, 1641, 1611, 1552, 1431, 1263 (KBr)	2.00 (3H, s), 3.76 (2H, s), 3.88 (3H, s), 3.89 (3H, s), 6.91 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.20 (1H, d, J=8.08 Hz), 7.67 (1H, br s), 7.82 (2H, d, J=8.44 Hz), 7.93 (2H, d, J=8.48 Hz), 10.56 (1H, br s), 11.28 (1H, br s), 12.76 (1H, br s)	452 (M++1), 154 (100)

表 54

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
191		黄色結晶	213.5-215.5	3328, 1651, 1614, 1560, 1503, 1332 (KBr)	2.17 (3H, s), 3.81 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.95 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.25-7.26 (1H, m), 7.50 (1H, s like), 7.83 (2H, d, J=9.04 Hz), 8.29 (2H, d, J=9.04 Hz), 8.35 (1H, br s), 11.32 (1H, br s)	453 (M++1), 154 (100)
192		黄色結晶	138-141	3324, 1651, 1610, 1510, 1268, 1224 (KBr)	2.16 (3H, s), 3.82 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.96 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.28-7.36 (3H, m), 7.53 (1H, d, J=1.48 Hz), 7.72 (1H, br s), 11.37 (1H, s)	560 (M+), 154 (100)
193		黄色油状物		1764, 1712, 1651, 1610, 1306, 1265, 1123 (NaCl)	1.64 (9H, s), 2.14 (3H, s), 2.29 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.94-7.15 (3H, m), 7.37-7.71 (2H, m), 8.26-8.70 (2H, m)	551 (M++1), 154 (100)
194		黄色結晶	148-151	3402, 1768, 1654, 1610, 1492, 1266, 1201 (KBr)	2.02 (3H, s), 2.16 (3H, s), 3.85 (2H, s), 3.89 (3H, s), 3.90 (3H, s), 7.10-7.16 (2H, m), 7.36 (1H, d, J=6.72 Hz), 7.56 (1H, br s), 8.22 (1H, d, J=6.32 Hz), 8.35-8.36 (1H, m)	495 (M++1), 154 (100)

表 55

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
195		黄色結晶	134-136.5	3410, 2951, 1656, 1609, 1268 (KBr)	2.01 (3H, s), 3.76 (2H, s), 3.88 (3H, s), 3.89 (3H, s), 6.93 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.25 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.32-7.36 (1H, m), 7.75 (1H, br s), 8.24 (1H, d, J=7.68 Hz), 8.57 (1H, d, J=4.68 Hz), 11.58 (1H, br s)	453 (M++1), 154 (100)
196		黄色油状物		2980, 1769, 1687, 1650, 1610, 1448, 1265, 1140 (NaCl)	1.60 (9H, s), 2.12 (3H, s), 2.39 (3H, s), 3.88 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 7.11 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.39 (1H, dd, J=8.28, 1.64 Hz), 7.81 (1H, d, J=1.60 Hz), 8.26-8.38 (2H, m), 8.82-8.84 (1H, m), 8.29 (1H, br s)	551 (M++1), 154 (100)
197		黄色結晶	123-125	3410, 2948, 1769, 1698, 1654, 1612, 1267 (KBr)	2.02 (3H, s), 2.18 (3H, s), 3.85 (2H, s), 3.89 (3H, s), 3.90 (3H, s), 7.14 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.38 (1H, dd, J=8.40, 1.92 Hz), 7.52 (1H, d, J=1.88 Hz), 8.18-8.30 (2H, m), 8.83-8.84 (1H, m), 11.08 (1H, s), 12.90-13.50 (1H, br s)	495 (M++1), 154 (100)
198		黄色結晶	238-241	3280, 2954, 1654, 1611, 1533, 1311, 1267 (KBr)	2.00 (3H, s), 3.77 (2H, s), 3.88 (3H, s), 3.89 (3H, s), 6.98 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.25-7.28 (1H, m), 7.82 (1H, d, J=1.88 Hz), 8.30-8.38 (2H, m), 8.84 (1H, s), 11.16 (1H, br s), 11.60-11.80 (1H, m), 13.17-13.20 (1H, m)	453 (M++1), 154 (100)

表 56

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
199		黄色結晶	188.5-191	1764, 1654, 1611, 1520, 1268, 1163 (KBr)	1.59 (9H, s), 2.14 (3H, s), 2.29 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 7.07-7.12 (2H, m), 7.39 (1H, dd, J=8.32, 1.88 Hz), 7.70 (1H, d, J=1.76 Hz), 8.27 (1H, dd, J=7.80, 1.68 Hz), 8.64-8.66 (1H, m), 11.48 (1H, br s)	565 (M++1), 154 (100)
200		黄色結晶	127-129	3352, 1699, 1648, 1610, 1520, 1269, 1159 (KBr)	1.53 (9H, s), 2.14 (3H, s), 3.79 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.50 (1H, br s), 6.89-6.92 (1H, m), 7.19-7.25 (1H, m), 7.38-7.50 (5H, m), 7.97 (1H, br s), 11.86 (1H, s)	523 (M++1), 154 (100)
201		黄色油状物		1764, 1651, 1609, 1538, 1264 (NaCl)	2.10 (3H, s), 2.32 (3H, s), 3.87 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 7.06-7.09 (1H, m), 7.27-7.36 (2H, m), 7.65 (1H, br s), 8.25-8.38 (3H, m), 8.57-8.58 (1H, m)	451 (M++1), 154 (100)
202		黄色結晶	149.5-152	3416, 3080, 1672, 1649, 1612, 1549, 1150 (KBr)	2.11 (3H, s), 2.94 (3H, s), 3.85 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.91 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.16 (1H, d, J=7.32 Hz), 7.79-7.83 (1H, m), 8.02 (1H, br s), 8.41 (1H, d, J=4.72 Hz), 9.24 (1H, d, J=8.88 Hz), 9.53 (1H, br s), 11.04 (1H, br s)	409 (M++1), 154 (100)

表 57

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
203		黄色結晶	199.5-201.5	3246, 2948, 1702, 1613, 1513, 1139 (KBr)	1.99 (3H, s), 2.29 (3H, s), 3.76 (2H, s), 3.88 (3H, s), 3.89 (3H, s), 6.95 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.25-7.27 (1H, m), 7.53 (1H, br s), 8.16 (2H, d, J=6.76 Hz), 8.71 (2H, d, J=6.88 Hz)	409 (M++1), 154 (100)
204		黄色油状物		3366, 2944, 1648, 1609, 1516, 1265 (KBr)	2.10 (3H, s), 3.75 (2H, s), 3.93 (3H, s), 3.94 (3H, s), 6.66 (2H, d, J=8.68 Hz), 6.88 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.16-7.27 (3H, m), 7.43 (1H, d, J=1.16 Hz), 8.14 (1H, br s)	423 (M++1), 108 (100)
205		黄色結晶	162-164	3366, 2940, 1650, 1613, 1513, 1268 (KBr)	2.07 (3H, s), 3.84 (2H, s), 3.96 (3H, s), 3.97 (3H, s), 6.89 (1H, d, J=8.28 Hz), 7.24-7.38 (3H, m), 7.78-7.85 (3H, m)	423 (M++1), 108 (100)
206		黄色油状物		1760, 1648, 1610, 1540, 1196 (NaCl)	2.00 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.79 (2H, s), 3.98 (3H, s), 4.01 (3H, s), 7.19-7.33 (3H, m), 7.57 (1H, d, J=7.04 Hz), 8.15 (1H, br s), 8.24 (1H, d, J=8.04 Hz), 8.37 (1H, d, J=4.68 Hz), 8.58 (1H, d, J=2.20 Hz)	451 (M++1), 154 (100)

表 58

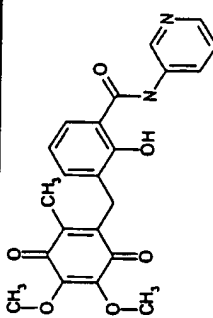
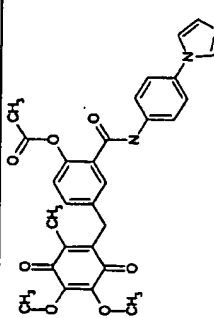
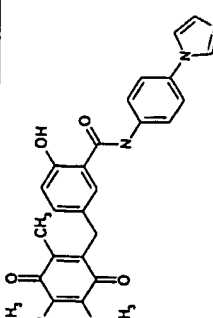
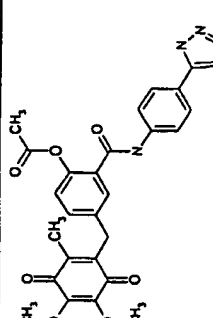
実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
207		黄色結晶	169-171	3258, 1651, 1611, 1544, 1269 (KBr)	2.10 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.86 (1H, t, J=7.76 Hz), 7.29-7.37 (2H, m), 7.50 (1H, d, J=7.00 Hz), 8.20 (1H, dd, J=8.20, 1.60 Hz), 8.28 (1H, br s), 8.43 (1H, d, J=3.72 Hz), 8.68 (1H, d, J=2.44 Hz), 11.95 (1H, s)	409 (M++1), 154 (100)
208		黄色結晶	116.5-118.5	3135, 1767, 1653, 1611, 1523, 1267 (KBr)	2.12 (3H, s), 2.33 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.06-7.09 (1H, m), 7.20-7.27 (2H, m), 7.34-7.44 (3H, m), 7.66 (1H, br s), 7.72 (2H, d, J=8.80 Hz), 7.75-7.83 (1H, m), 8.18 (1H, br s)	516 (M++1), 154 (100)
209		黄色結晶	119-121.5	3324, 3124, 1651, 1611, 1522, 1267 (KBr)	2.16 (3H, s), 3.81 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.95 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.22-7.29 (3H, m), 7.43 (2H, d, J=8.76 Hz), 7.53 (1H, d, J=1.76 Hz), 7.74 (2H, d, J=8.80 Hz), 7.87 (1H, s), 8.42 (1H, s), 11.50-11.90 (1H, br s)	474 (M++1), 154 (100)
210		黄色油状物		3346, 1768, 1648, 1611, 1267, 1188 (KBr)	2.12 (3H, s), 2.34 (3H, s), 3.90 (2H, s), 3.97 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.82-6.84 (1H, m), 7.07 (1H, d, J=8.28 Hz), 7.20-7.46 (2H, m), 7.62-7.81 (5H, m), 8.10-8.20 (1H, m), 8.38 (1H, br s)	516 (M++1), 154 (100)

表 59

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
211		黄色結晶	182-185.5	3200, 2946, 1653, 1610, 1540, 1268 (KBr)	2.01 (3H, s), 3.77 (2H, s), 3.89 (3H, s), 3.90 (3H, s), 6.68-6.69 (1H, m), 6.90 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.18-7.21 (1H, m), 7.72-7.82 (5H, m), 10.39-10.41 (1H, br s), 11.48-11.49 (1H, br s), 12.80-12.83 (1H, br s)	474 (M++1), 154 (100)
212		黄色油状物		1767, 1636, 1611, 1325, 1125 (NaCl)	1.89 (3H, s), 2.29 (3H, s), 3.44 (3H, s), 3.63 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.88-6.89 (1H, m), 6.97 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.11-7.13 (1H, m), 7.26-7.29 (2H, m), 7.49 (2H, d, J=8.16 Hz)	532 (M++1), 154 (100)
213		黄色油状物		3322, 1636, 1610, 1325, 1126 (NaCl)	1.76 (3H, s), 3.35 (2H, s), 3.48 (3H, s), 3.96 (3H, s), 3.98 (3H, s), 6.53 (1H, d, J=1.80 Hz), 6.86 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.02 (1H, dd, J=8.56, 1.96 Hz), 7.20 (2H, d, J=8.32 Hz), 7.58 (2H, d, J=8.36 Hz), 10.24 (1H, s)	490 (M++1, 100)
214		黄色結晶	200.5-202	3322, 2982, 1706, 1653, 1610, 1297, 1268 (KBr)	1.61 (9H, s), 2.15 (3H, s), 3.79 (2H, s), 3.97 (3H, s), 3.98 (3H, s), 6.93 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.22 (1H, dd, J=8.56, 1.88 Hz), 7.47 (1H, d, J=1.68 Hz), 7.66 (2H, d, J=8.64 Hz), 8.01 (2H, d, J=8.64 Hz), 8.20 (1H, s like), 11.60-11.62 (1H, br s)	508 (M++1), 154 (100)

表 60

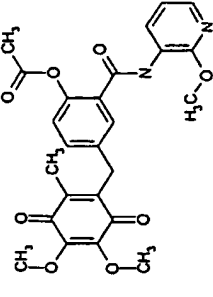
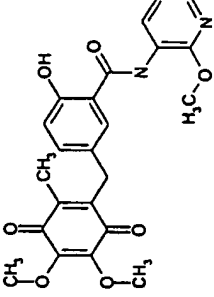
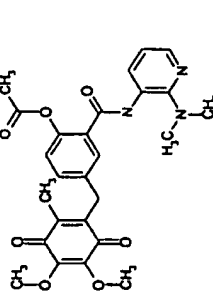
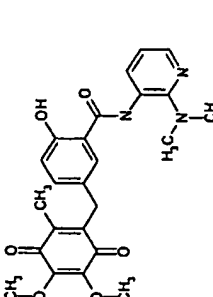
実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
215		黄色結晶	111-112	1773, 1666, 1611, 1526, 1266 (NaCl)	2.12 (3H, s), 2.38 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 4.05 (3H, s), 6.93-6.96 (1H, m), 7.09 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.37 (1H, d, J=8.44 Hz), 7.81 (1H, s like), 7.89 (1H, d, J=5.04 Hz), 8.75 (1H, d, J=7.72 Hz), 8.88 (1H, s like)	481 (M++1), 184 (100)
216		黄色結晶	112-114	3186, 1654, 1632, 1611, 1250 (KBr)	2.17 (3H, s), 3.82 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 4.11 (3H, s), 6.93-6.97 (2H, m), 7.26-7.29 (1H, m), 7.36 (1H, s like), 7.92-7.94 (1H, m), 8.52 (1H, s like), 8.60 (1H, d, J=7.88 Hz), 11.70 (1H, s)	439 (M++1), 154 (100)
217		黄色油状物		1773, 1665, 1611, 1508, 1266 (NaCl)	2.13 (3H, s), 2.36 (3H, s), 2.76 (6H, s), 3.90 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.04-7.11 (2H, m), 7.38 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.84 (1H, s like), 8.10-8.12 (1H, m), 8.68 (1H, d, J=8.00 Hz), 9.10 (1H, s like)	494 (M++1), 315 (100)
218		黄色油状物		3284, 1648, 1610, 1522, 1266 (NaCl)	2.16 (3H, s), 2.82 (6H, s), 3.82 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.95 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.07-7.10 (1H, m), 7.30-7.39 (2H, m), 8.14 (1H, d, J=4.88 Hz), 8.59 (1H, d, J=1.44 Hz), 8.61 (1H, d, J=1.48 Hz), 9.04-9.06 (1H, br s)	452 (M++1), 136 (100)

表 61

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
219		黄色結晶	118.5-120	1789, 1660, 1610, 1530, 1486, 1269 (KBr)	2.11 (3H, s), 2.34 (3H, s), 3.80 (3H, s), 3.86 (3H, s), 3.88 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.59-6.62 (1H, m), 6.82 (1H, d, J=8.96 Hz), 7.07 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.33-7.36 (1H, m), 7.79 (1H, s like), 8.27-8.28 (1H, m), 8.91-8.92 (1H, m)	510 (M++1), 154 (100)
220		黄色結晶	130-132	3324, 1661, 1608, 1540, 1500, 1264 (KBr)	2.17 (3H, s), 3.80 (3H, s), 3.81 (3H, s), 3.94 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 6.64 (1H, d, J=8.92 Hz), 6.85 (1H, d, J=8.96 Hz), 6.93 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.26-7.36 (2H, m), 8.09-8.11 (1H, m), 8.70 (1H, s like), 11.90 (1H, s)	468 (M++1), 154 (100)
221		黄色結晶	178-180	1673, 1612, 1530, 1494, 1271 (KBr)	2.12 (3H, s), 3.86 (2H, s), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 4.08 (3H, s), 6.98 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.26-7.40 (2H, m), 8.07-8.12 (2H, m), 9.00 (1H, d, J=8.16 Hz), 10.68 (1H, s like)	457 (M++1), 154 (100)
222		黄色油状物		1768, 1653, 1611, 1508, 1266, 1200 (KBr)	2.14 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.08-3.12 (4H, m), 3.86-3.90 (6H, m), 3.99 (3H, s), 4.00 (3H, s), 7.07-7.12 (2H, m), 7.38 (1H, dd, J=8.32, 2.08 Hz), 7.73 (1H, d, J=1.68 Hz), 8.14 (1H, dd, J=4.80, 1.56 Hz), 8.68 (1H, d, J=7.72 Hz), 8.88 (1H, s like)	536 (M++1), 154 (100)

表 62

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
223		黄色結晶	210-212.5	3296, 1648, 1609, 1518, 1266 (KBr)	2.17 (3H, s), 3.12-3.15 (4H, m), 3.82 (2H, s), 3.98-4.02 (10H, m), 6.95 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.12-7.16 (1H, m), 7.26-7.30 (1H, m), 7.49 (1H, s like), 8.18 (1H, dd, J=4.80, 1.44 Hz), 8.64 (1H, dd, J=8.00, 1.32 Hz), 9.07 (1H, s like), 11.94 (1H, s)	494 (M++1), 154 (100)
224		黄色油状物		3313, 1768, 1654, 1611, 1526, 1492 (KBr)	2.09 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.45-3.48 (4H, m), 3.80-3.96 (6H, m), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.65 (1H, d, J=9.12 Hz), 7.05 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.31 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.64 (1H, s like), 7.98-8.01 (1H, m), 8.13-8.20 (2H, m)	536 (M++1), 154 (100)
225		黄色結晶	102.5-105	3400, 1646, 1611, 1495, 1266 (KBr)	2.15 (3H, s), 3.49-3.53 (4H, m), 3.81-3.98 (6H, m), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.68 (1H, d, J=9.04 Hz), 6.92 (1H, d, J=8.60 Hz), 7.20-7.25 (1H, m), 7.43 (1H, s like), 7.80-7.84 (2H, m), 8.25 (1H, s like), 11.83 (1H, s)	494 (M++1), 154 (100)
226		黄色油状物		1768, 1648, 1612, 1582, 1267, 1200 (KBr)	2.10 (3H, s), 2.33 (3H, s), 3.86 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 7.07 (1H, d, J=8.44 Hz), 7.35-7.42 (2H, m), 7.61 (1H, s like), 7.70 (1H, s like), 8.28 (1H, d, J=5.56 Hz), 8.40-8.42 (1H, br s)	485 (M++1), 154 (100)

表 63

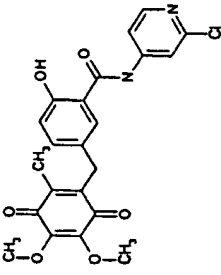
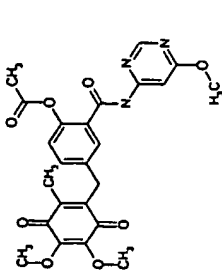
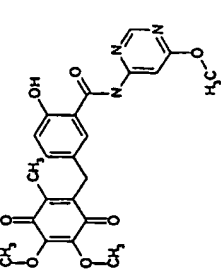
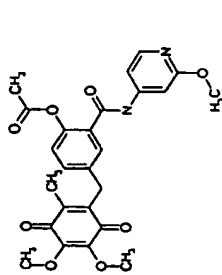
実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
227		黄色結晶	142-144	3272, 1653, 1611, 1582, 1501, 1266 (KBr)	2.15 (3H, s), 3.79 (2H, s), 3.97 (3H, s), 3.99 (3H, s), 6.95 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.26-7.28 (1H, m), 7.48-7.50 (2H, m), 7.74 (1H, s like), 8.27 (1H, s like), 8.35 (1H, d, J=5.60 Hz), 11.16 (1H, s)	443 (M++1), 154 (100)
228		黄色結晶	138.5-141	1772, 1700, 1653, 1611, 1570, 1517, 1267, 1207 (KBr)	2.12 (3H, s), 2.40 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.99 (9H, s like), 7.11 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.39 (1H, dd, J=8.40, 2.24 Hz), 7.66 (1H, s like), 7.79 (1H, d, J=2.16 Hz), 8.46 (1H, s like), 9.00-9.02 (1H, br s)	482 (M++1), 154 (100)
229		黄色結晶	209.5-211.5	2920, 1686, 1612, 1590, 1500, 1269, 1194 (KBr)	2.13 (3H, s), 3.80 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.02 (3H, s), 6.93 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.24-7.26 (1H, m), 7.31 (1H, s like), 7.50-7.51 (1H, m), 8.52 (1H, s like), 8.88-8.90 (1H, br s), 11.4-11.51 (1H, br s)	439 (M+), 154 (100)
230		黄色結晶	138-140.5	1773, 1701, 1650, 1611, 1570, 1267, 1206 (KBr)	2.12 (3H, s), 2.40 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.99-4.01 (9H, m), 7.11 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.26-7.27 (1H, m), 7.39 (1H, d, J=8.36 Hz), 7.66 (1H, s like), 7.79 (1H, s like), 8.46 (1H, s like), 8.98-8.99 (1H, br s)	481 (M++1), 154 (100)

表 64

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
231		黄色結晶	218-220.5	3269, 1686, 1611, 1567, 1503, 1195 (KBr)	2.13 (3H, s), 3.80 (2H, s), 3.98 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.02 (3H, s), 6.93 (1H, d, J=8.48 Hz), 7.23-7.26 (1H, m), 7.51 (1H, s like), 7.66 (1H, s like), 8.52 (1H, s like), 8.85-8.87 (1H, br s), 11.50-11.52 (1H, br s)	439 (M ⁺⁺¹), 154 (100)
232		白色結晶	110-112	2992, 2827, 1770, 1695, 1210 (KBr)	2.11 (3H, s), 2.21 (3H, s), 2.22 (3H, s), 2.30 (3H, s), 3.57 (3H, s), 3.64 (3H, s), 4.08 (2H, s), 6.97 (1H, d, J=8.32 Hz), 7.27 (1H, d, J=2.00 Hz), 7.89 (1H, d, J=1.76 Hz)	372 (M ⁺ , 100)
233		黄色結晶	157-159.5	2951, 1756, 1683, 1648, 1213 (KBr)	2.02 (3H, s), 2.03 (3H, s), 2.13 (3H, s), 2.32 (3H, s), 3.89 (2H, s), 7.02 (1H, d, J=8.28 Hz), 7.44 (1H, dd, J=8.32, 1.48 Hz), 7.91 (1H, d, J=2.08 Hz)	343 (M ⁺⁺¹), 154 (100)
234		黄色結晶	180-181	1758, 1668, 1644, 1526, 1327 (KBr)	2.02 (3H, s), 2.03 (3H, s), 2.12 (3H, s), 2.31 (3H, s), 3.90 (2H, s), 7.06 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.36 (1H, dd, J=8.24, 2.04 Hz), 7.06-7.65 (3H, m), 7.71 (2H, d, J=8.56 Hz), 8.16 (1H, s)	486 (M ⁺⁺¹), 154 (100)

表 65

実施例番号	構造	性状	mp (°C)	IR (cm ⁻¹)	NMR (ppm)	FAB MS
235		黄色結晶	233-235	3168, 1676, 1642, 1544, 1321 (KBr)	2.02 (3H, s), 2.03 (3H, s), 2.17 (3H, s), 3.82 (2H, s), 5.93 (1H, d, J=8.56 Hz), 7.22-7.26 (1H, m), 7.46 (1H, d, J=1.44 Hz), 7.66 (2H, d, J=8.56 Hz), 7.75 (2H, d, J=8.52 Hz), 8.16 (1H, s), 11.52 (1H, s)	444 (M++1), 154 (100)
236		黄色結晶	130-131	1768, 1670, 1648, 1518, 1302 (KBr)	2.02 (3H, s), 2.03 (3H, s), 2.14 (3H, s), 2.39 (3H, s), 3.92 (2H, s), 7.10 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.29-7.33 (1H, m), 7.40 (1H, dd, J=8.36 1.44 Hz), 7.78 (1H, d, J=1.92 Hz), 8.15 (1H, dd, J=4.64, 1.64 Hz), 8.78-8.80 (1H, br s), 8.91 (1H, dd, J=8.12, 1.08 Hz)	453 (M++1), 154 (100)
237		黄色結晶	199-201	3270, 1675, 1639, 1531, 1505, 1310 (KBr)	2.03 (3H, s), 2.04 (3H, s), 2.15 (3H, s), 3.85 (2H, s), 6.96 (1H, d, J=8.52 Hz), 7.31-7.35 (2H, m), 7.42 (1H, d, J=1.52 Hz), 8.18 (1H, dd, J=4.68 1.64 Hz), 8.57 (1H, s like), 8.80 (1H, dd, J=8.16, 1.64 Hz), 11.32 (1H, s)	411 (M++1), 154 (100)
238		黄色結晶	245-247	3250, 2414, 1676, 1642, 1589, 1513, 1302 (KBr)	1.95 (3H, s), 1.96 (3H, s), 2.02 (3H, s), 3.78 (2H, s), 6.91 (1H, d, J=8.44 Hz), 7.20 (1H, d, J=8.40 Hz), 7.61-7.70 (3H, m), 8.46 (2H, d, J=5.96 Hz), 10.58-10.59 (1H, br s), 11.16-11.18 (1H, br s)	377 (M++1), 154 (100)

実験例 1. NF- κ B 結合配列によって制御されているルシフェラーゼ
プラスミド (pNF κ B-Luc、ストラタジーン社、米国) を安定導入し
たヒト肺癌由来株細胞 A549 (A549/NF- κ BLuc) に対する反応

A549 細胞 (ATCC CCL185) にリポフェクトアミン (ライフテック
オリエンタル社、東京) を用いて、常法に従い pNF κ B-Luc と pSV
2neo (クローンテック社、米国) を同時にトランスフェクションし
、G418 硫酸塩 (1 mg/ml、ライフテックオリエンタル社) を培地に
添加することで pNF κ B-Luc が安定導入された細胞 A549/NF- κ BLu
c を選択した。

A549/NF- κ BLuc に実施例で得られた化合物を添加し、その 1 時
間後に NF- κ B を活性化することができる IL-1 β を添加し、さらに 3
時間インキュベーションを続けた。実施例で得られた化合物は、I
L-1 β の刺激による NF- κ B の活性化を抑制することが、ルシフェラ
ーゼ活性を指標とすることで明らかとなった。その IC₅₀ 値を表に
示した。

置換安息香酸誘導体の NF- κ B 阻害活性 (IC₅₀)

実施例 57	29 μ M
実施例 60	19 μ M
実施例 61	31 μ M
実施例 64	33 μ M
実施例 65	37 μ M
実施例 70	15 μ M
実施例 71	36 μ M
実施例 72	43 μ M
実施例 73	31 μ M
実施例 76	7 μ M
実施例 77	35 μ M

实施例78		57 μ M
实施例79		27 μ M
实施例80		82 μ M
实施例82		84 μ M
实施例84		63 μ M
实施例85		65 μ M
实施例86		27 μ M
实施例87		19 μ M
实施例89		45 μ M
实施例92		49 μ M
	(HCl)	46 μ M
实施例94		45 μ M
实施例95		35 μ M
	(pTsOH)	51 μ M
实施例104		29 μ M
实施例106		70 μ M
实施例107		84 μ M
实施例108		67 μ M
实施例109		46 μ M
实施例110		34 μ M
实施例111		25 μ M
实施例112		14 μ M
实施例114		48 μ M
实施例115		36 μ M
实施例116		17 μ M
实施例117		20 μ M
实施例118		8.3 μ M

实施例119	13 μ M
实施例120	1.7 μ M
实施例121	64 μ M
实施例124	46 μ M
实施例125	19 μ M
实施例126	24 μ M
实施例127	24 μ M
实施例128	19 μ M
实施例130	59 μ M
实施例142	9 μ g/ml
实施例146	11 μ g/ml
实施例147	19 μ g/ml
实施例148	3 μ g/ml
实施例149	25 μ g/ml
实施例150	4 μ g/ml
实施例157	7 μ g/ml
实施例158	7 μ g/ml
实施例163	30 μ g/ml
实施例164	20 μ g/ml
实施例171	26 μ g/ml
实施例173	9 μ g/ml
实施例174	6 μ g/ml
实施例180	23 μ g/ml
实施例181	11 μ g/ml
实施例184	56 μ g/ml
实施例185	11 μ g/ml
实施例186	2 μ g/ml

実施例187	2 μ g/ml
実施例188	9 μ g/ml
実施例191	4 μ g/ml
実施例199	16 μ g/ml
実施例200	17 μ g/ml
実施例201	16 μ g/ml
実施例202	20 μ g/ml
実施例203	30 μ g/ml
実施例204	47 μ g/ml
実施例205	50 μ g/ml
実施例206	87 μ g/ml
実施例207	98 μ g/ml
実施例208	19 μ g/ml
実施例214	10 μ g/ml
実施例216	10 μ g/ml
実施例220	66 μ g/ml
実施例221	46 μ g/ml
実施例222	77 μ g/ml
実施例223	81 μ g/ml
実施例224	24 μ g/ml
実施例225	24 μ g/ml
実施例226	19 μ g/ml
実施例227	20 μ g/ml
実施例228	64 μ g/ml
実施例229	59 μ g/ml
実施例235	5 μ g/ml
実施例237	5 μ g/ml

実験例 2. in vivo 敗血症モデルでの効果

7 週齢雌性 C3H/HeN マウスに N-アセチルガラクトサミン (GalN、20 mg、シグマ社) と リポ多糖 (LPS、5 micro g、シグマ社) の混合液を刺激剤として腹腔内投与した。その直後に vehicle (0.5% ヒドロキシプロピルセルロース (HPC)、日本曹達株式会社製) に懸濁した 実施例 112 の化合物を それぞれ 10 mg/kg、30 mg/kg、100 mg/kg となるように腹腔内投与した。刺激剤投与 60 分後の肝臓中 TNF- α mRNA 量、IL-1 α mRNA 量をそれぞれ real-time PCR 法で測定し、90 分後の血漿中 TNF- α 量をマウス TNF- α ELISA キット (バイオソース社) で測定した。real-time PCR 法は、肝臓より mRNA を抽出した後、SuperScript Preamplification System (ライフ テックオリエンタル社) の方法に従って得た cDNA を鋳型にし、PCR 定量システム (PE バイオシステムズジャパン株式会社) のプロトコールに従い PRISM7700 (PE バイオシステムズジャパン株式会社) を用いて検出した。検出には、以下のプライマー、TaqMan プローブを用いた。

TNF- α

Forward: CAT CTT CTC AAA ATT CGA GTG ACA A

Reverse: TGG GAG TAG ACA AGG TAC AAC CC

Probe: CAC GTC GTA GCA AAC CAC CAA GTG GA

IL-1 β

Forward: CAA CCA ACA AGT GAT ATT CTC CAT G

Reverse: GAT CCA CAC TCT CCA GCT GCA

Probe: CTG TGT AAT GAA AGA CGG CAC ACC CAC C

各サンプルの RNA 量はグリセルアルデヒド-3-リン酸デヒドロゲナーゼ (GAPDH) 遺伝子の発現量で補正した。

ELISA は、キット添付のマニュアルに従って行った。Vehicle 群

との比較はStat-View (SAS Institute) を用いてDunnett多重比較検定を行った。

図1に示すようにvehicle 群は、肝臓中の顕著な TNF- α mRNA 量の増加と共に、血漿中TNF- α 量の増加が認められた。また肝臓中 IL-1 β mRNA 量の増加も認められた。一方、実施例112の化合物を投与した群については、用量依存的に肝臓中の TNF- α mRNA や血漿中TNF- α 量を抑制した。また、肝臓中の IL-1 β mRNA 量についても抑制が見られた。

実験例 3. 敗血症モデルにおける経口投与での効果

実験例2と同様に、7週齢雌性 C3H/HeN マウスにGalN (20 mg) と LPS (2 micro g)の混合液を刺激剤として腹腔内投与した。その10分前に、vehicle (0.5% HPC)に懸濁した実施例112の化合物、実施例157の化合物をそれぞれ 10 mg/kg, 30 mg/kg, 100 mg/kg となるように経口投与した。刺激剤投与60分後の肝臓中 TNF- α mRNA 量を real-time PCR 法で測定し、90分後の血漿中TNF- α 量をマウス TNF- α ELISA キットで測定した。Vehicle群との比較はStat-Viewを用いてDunnett多重比較検定を行った。

実施例112の化合物(図2)、実施例157の化合物(図3)を経口投与した群についても、用量依存的に肝臓中の TNF- α mRNA や血漿中 TNF- α 量を抑制した。

実験例 4. 急性炎症モデルにおける経口投与での効果

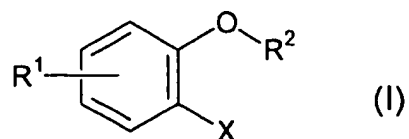
5週齢のWister系雄性ラットの右後肢足蹠に 1 w/v% ラムダ-カラゲニン(シグマ社)0.1mlを皮内投与し、その直後にvehicle (0.5% HPC)に懸濁した実施例112の化合物、実施例157の化合物をそれぞれ 100 mg/kgになるように経口投与した。陽性対照としてインドメタシン(シグマ社)を、10 mg/kg で経口投与した。足浮腫率は、ボリュームメーター (TK-101、ユニコム製)を用いて、(カラゲ

ニン投与 2 時間後の足容積-投与前の足容積) /投与前の足容積x100
で算出した。Vehicle群と薬物投与群との比較は、F 検定により分散性検定を行った後、等分散の場合には Student-t 検定で、等分散でない場合には Aspin Welch-t 検定で行った。

図 4 に示すとおり、実施例112の化合物、実施例157の化合物は、経口投与によってカラゲニンによる急性炎症（足浮腫）を有意に抑制した。

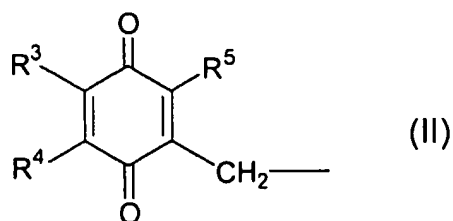
請 求 の 範 囲

1. 次の一般式 (I) :

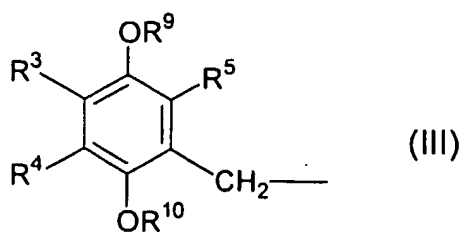


(式中、

R¹ は、下記の一般式 (II) :



または下記の一般式 (III) :



(式中、R³、R⁴およびR⁵は各々独立に水素原子、炭素数1～6のアルキル基または炭素数1～6のアルコキシ基であり、R⁹およびR¹⁰は各々独立に水素原子、炭素数1～6のアルキル基または炭素数2～11のアシル基を示す) であり；

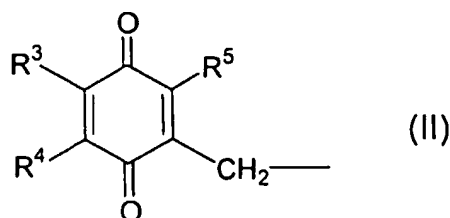
R²は、水素原子、置換されていてもよい炭素数1～6の低級アルキル基、置換されていてもよい炭素数6～12のアリール基、置換されていてもよい炭素数4～11のヘテロアリール基、置換されて

いてもよい炭素数 7 ～ 14 のアラルキル基、置換されていてもよい炭素数 5 ～ 13 のヘテロアリールアルキル基を示すか、あるいは炭素数 2 ～ 11 のアシル基であり；

Xは、エステル化またはアミド化されていてもよいカルボキシル基を示す)

で表される新規置換安息香酸誘導体。

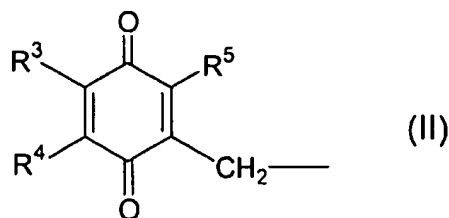
2. R^1 が、下記の一般式 (II)：



(式中、 R^3 および R^4 が各々独立に水素原子、メチル基またはメトキシ基を示す)

である請求項 1 に記載の新規置換安息香酸誘導体。

3. R^1 が、下記の一般式 (II)：



(式中、 R^5 が水素原子またはメチル基を示す)

である請求項 1 または 2 に記載の新規置換安息香酸誘導体。

4. R^2 が水素原子、メチル基、イソプロピル基、フェニル基、3-メトキシフェニル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、ベンジル基、3-ピリジルメチル基、4-ピリジルメチル基、アセチル基、カルボキシメチル基、メトキシカルボニルメチル基、*t*-ブトキシカルボニル

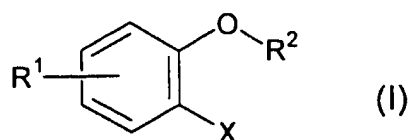
メチル基である請求項 1～3 のいずれか 1 項に記載の新規置換安息香酸誘導体。

5. Xが基- COOR^6 (式中、 R^6 は水素原子、置換されていてもよい炭素数 1～6 のアルキル基、置換されていてもよい炭素数 7～14 のアラルキル基を示す) である請求項 1～4 のいずれか 1 項に記載の新規置換安息香酸誘導体。

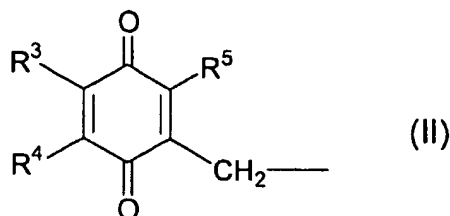
6. Xが基- CONR^7R^8 (式中、 R^7 および R^8 は各々独立に水素原子、置換されていてもよい炭素数 1～6 のアルキル基、置換されていてもよい炭素数 6～12 のアリール基、置換されていてもよい炭素数 4～11 のヘテロアリール基、置換されていてもよい炭素数 7～14 のアラルキル基、置換されていてもよい炭素数 5～13 のヘテロアリールアルキル基を示すか、あるいは R^7 および R^8 はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、更に窒素原子、酸素原子、硫黄原子を含んでいてもよい、あるいはまた縮合していてもよい異項環基を示す) である請求項 1～5 のいずれか 1 項に記載の新規置換安息香酸誘導体。

7. Xが基- CONR^7R^8 (式中、 R^7 および R^8 はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、置換されていてもよい炭素原子および窒素原子以外に、窒素原子、酸素原子、硫黄原子から選ばれる 1～3 個のヘテロ原子を含んでいてもよい 5～8 員環含窒素複素環基を示し、これらはその環上の炭素原子または硫黄原子がオキシド化されていてもよい) である請求項 1～4 のいずれか 1 項に記載の新規置換安息香酸誘導体。

8. 次の一般式 (I) において、



式中、 R^1 が、下記の一般式 (II)



(式中、 R^3 および R^4 がメチル基またはメトキシ基、 R^5 がメチル基を示す) であり； R^2 が水素原子、メチル基、イソプロピル基、フェニル基、3-メトキシフェニル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、ベンジル基、3-ピリジルメチル基、4-ピリジルメチル基、アセチル基、カルボキシメチル基、メトキシカルボニルメチル基、*t*-ブトキシカルボニルメチル基であり；Xは、エステル化またはアミド化されていてもよいカルボキシル基である請求項 1～7 のいずれか 1 項に記載の新規置換安息香酸誘導体。

9. 請求項 1～8 のいずれか 1 項に記載の新規置換安息香酸誘導体もしくはそのヒドロキノン体またはその薬理学的に許容し得る塩を有効成分とする NF- κ B 阻害剤。

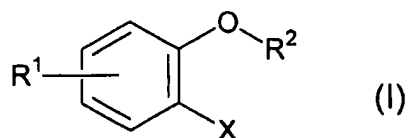
10. IL-1、TNF- α 、IL-2、IL-6、IL-8、iNOS、顆粒球コロニー刺激因子、インターフェロン- γ 、ICAM-1、VCAM-1、ELAM-1、主要組織適合抗原系クラス I、主要組織適合抗原系クラス II、 β -2 マイクログロブリン、免疫グロブリン軽鎖、血清アミロイド A、アンジオテンシノーゲン、補体 B、補体 C 4、c-myc、HIV、HTLV-1、SV-40、CMV および アデノウイルスからなる群より選ばれた 1 または 2 以上の物質の遺伝子の発現抑制剤である請求項 9 に記載の NF- κ B 阻害剤。

11. 炎症性疾患の予防または治療薬である請求項 9 または 10 に記載の NF- κ B 阻害剤。

12. 自己免疫性疾患の予防または治療薬である請求項 9 または 10 に記載の NF- κ B 阻害剤。

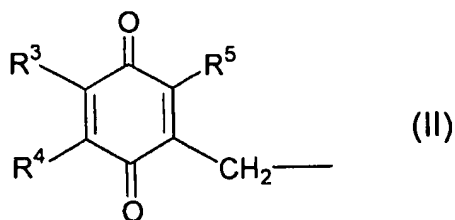
13. ウイルス性疾患の予防または治療薬である請求項 9 または 10 に記載の NF- κ B 阻害剤。

14. 次の一般式 (I) :

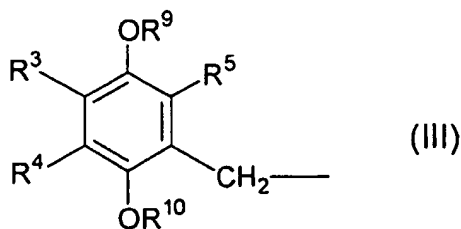


(式中、

R¹ は、下記の一般式 (II) :



または下記の一般式 (III) :



(式中、R³、R⁴ および R⁵ は各々独立に水素原子、炭素数 1 ～ 6 のアルキル基または炭素数 1 ～ 6 のアルコキシ基であり、R⁹ および R¹⁰ は各々独立に水素原子、炭素数 1 ～ 6 のアルキル基または炭素数 2 ～ 11 のアシル基を示す) であり；

R² は、水素原子、置換されていてもよい炭素数 1 ～ 6 の低級アルキ

ル基、置換されていてもよい炭素数6～12のアリール基、置換されていてもよい炭素数4～11のヘテロアリール基、置換されていてもよい炭素数7～14のアラルキル基、置換されていてもよい炭素数5～13のヘテロアリールアルキル基を示すか、あるいは炭素数2～11のアシル基であり；

Xは、エステル化またはアミド化されていてもよいカルボキシル基を示す)

で表される新規置換安息香酸誘導体もしくはそのヒドロキノン体またはその薬理学的に許容し得る塩を有効成分とするNF- κ Bの活性化に起因する疾患の予防または治療薬。

Fig.1

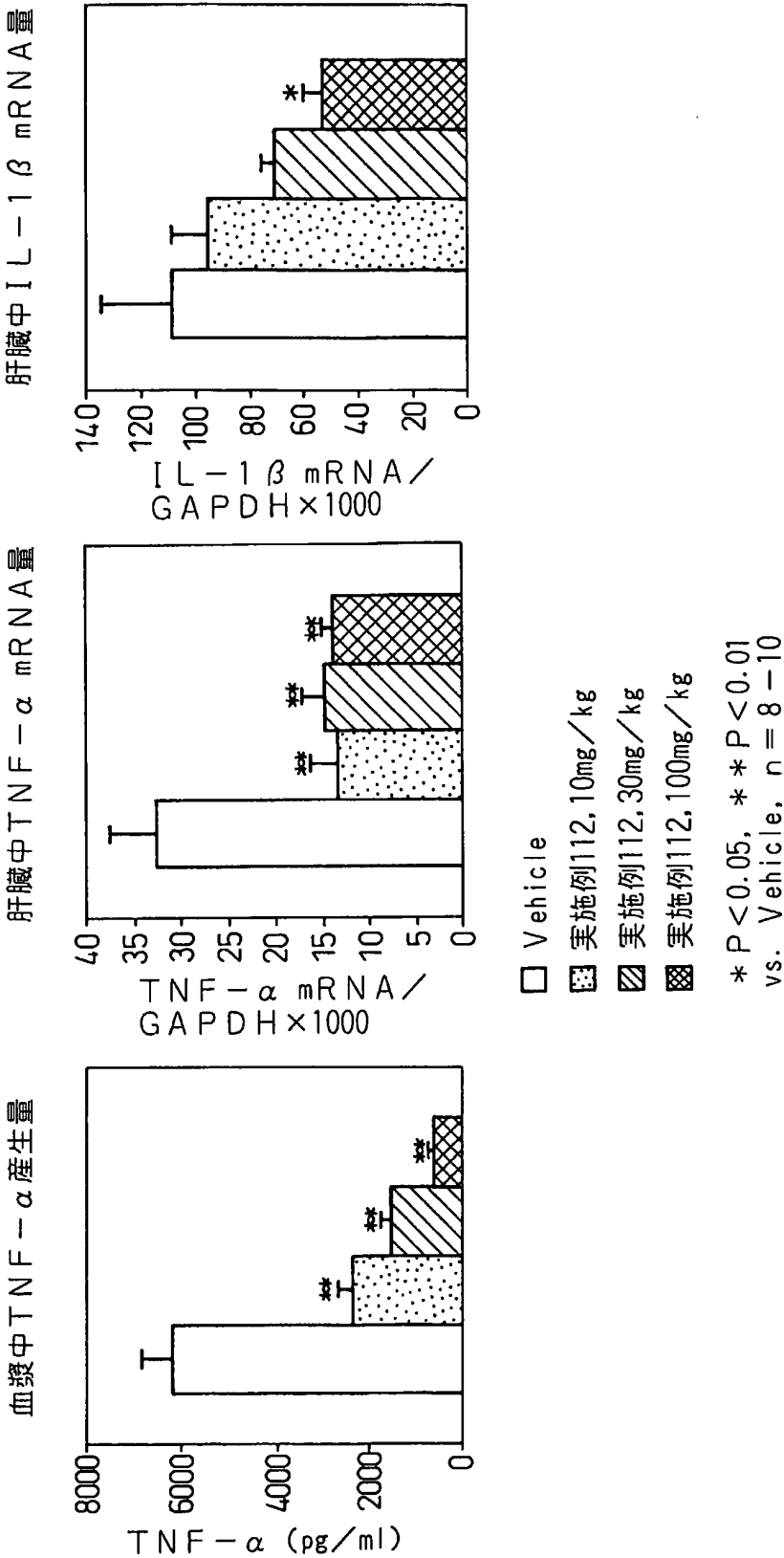


Fig.2

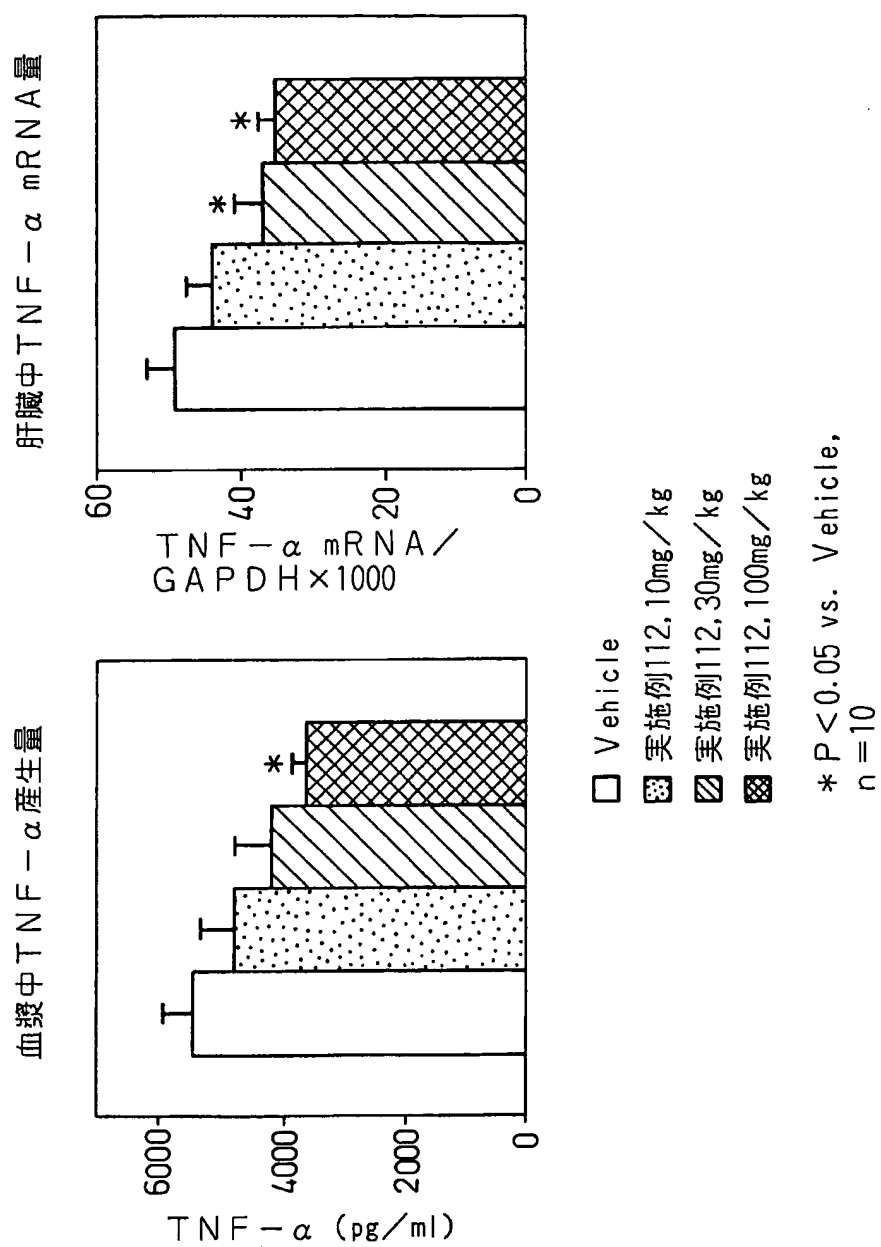


Fig.3

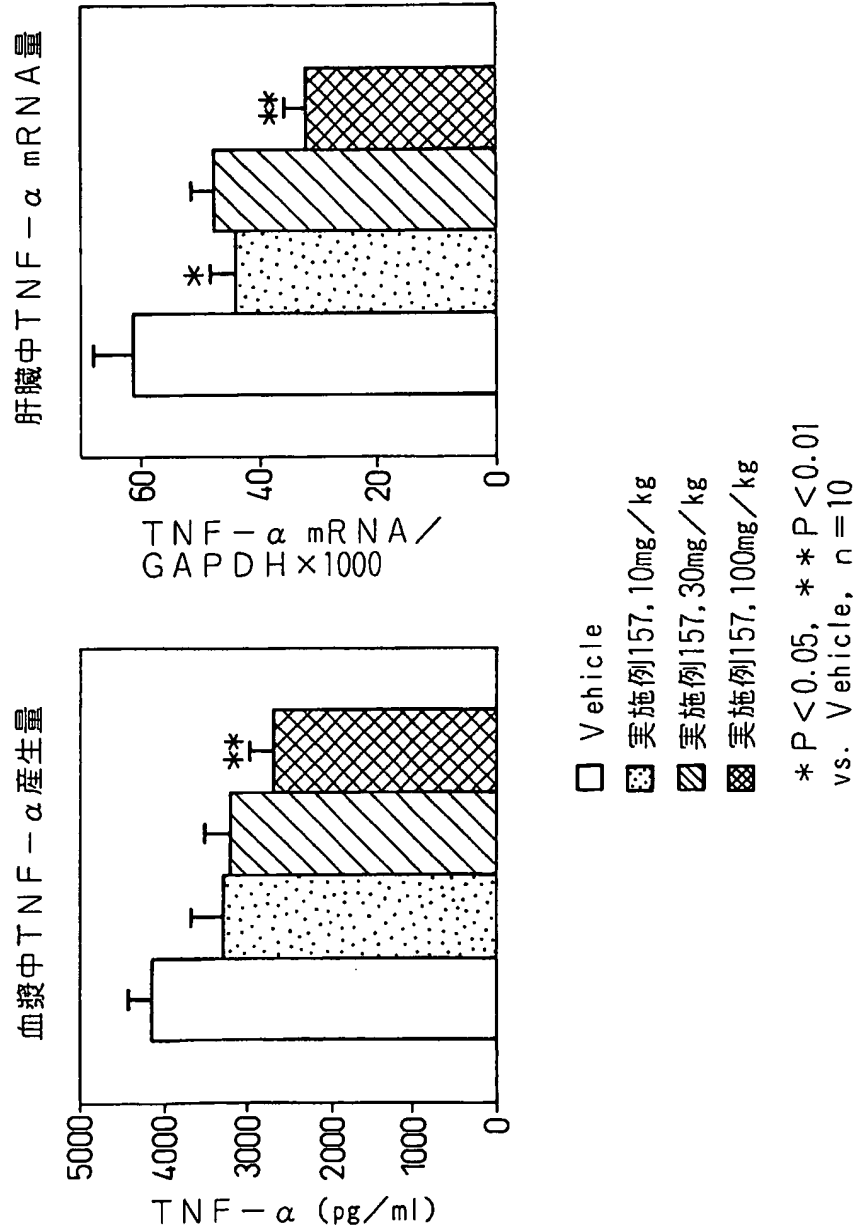
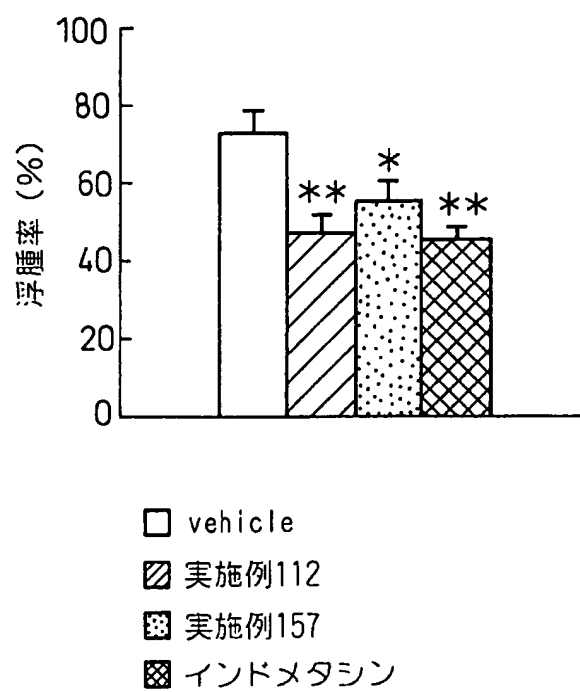


Fig.4



INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/03017

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07C65/24, 65/40, 69/157, 69/94, 235/64, 255/24, 255/63, 317/40, C07D295/18, 215/08, 233/02, 213/30, 213/75, 211/16, 231/12, 239/47, A61K31/192, 31/216, 31/235, 31/4406,

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07C65/24, 65/40, 69/157, 69/94, 235/64, 255/24, 255/63, 317/40, C07D295/18, 215/08, 233/02, 213/30, 213/75, 211/16, 231/12, 239/47, A61K31/192, 31/216, 31/235, 31/4406,

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	MANDER L. N. and WOOLIAS M., "Studies on Reductive Alkylation.", Aust. J. Chem., 1981, Vol.34, pages 2249 to 2252; compounds 4, 5	1, 4, 5 2, 3, 6-14
A	JP 7-291859 A (Eisai Co., Ltd.), 07 November, 1995 (07.11.95), Claims (Family: none)	1-14
A	EP 955372 A2 (Suntory Ltd.), 10 November, 1999 (10.11.99), Claims; Fig. 11 & JP 11-266872 A & US 6156516 A	1-14
A	WO 99/48491 A1 (Suntory Ltd.), 30 September, 1999 (30.09.99), Claims & EP 1008346 A1	1-14

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	"I" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"E" earlier document but published on or after the international filing date	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"&" document member of the same patent family
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search 12 June, 2002 (12.06.02)	Date of mailing of the international search report 25 June, 2002 (25.06.02)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/03017

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	JP 4-226937 A (Suntory Ltd.), 17 August, 1992 (17.08.92), Claims (Family: none)	1-14
A	JP 62-286949 A (Suntory Ltd.), 12 December, 1987 (12.12.87), Claims (Family: none)	1-14

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/03017

Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

(International Patent Classification (IPC))

Int.Cl⁷ 31/4409, 31/4453, 31/4545, 31/47, 31/4709, 31/5377, 31/603,
31/167, 31/609, 31/625, 31/277, 31/616, 31/5375, 31/44, 31/445,
31/415, 31/506, A61P29/00, 31/12, 37/00, 43/00

(According to International Patent Classification (IPC) or to both
national classification and IPC)

Continuation of B. FIELDS SEARCHED

Minimum Documentation Searched(International Patent Classification (IPC))

Int.Cl⁷ 31/4409, 31/4453, 31/4545, 31/47, 31/4709, 31/5377, 31/603,
31/167, 31/609, 31/625, 31/277, 31/616, 31/5375, 31/44, 31/445,
31/415, 31/506, A61P29/00, 31/12, 37/00, 43/00

Minimum documentation searched (classification system followed by
classification symbols)

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JPO2/03017

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07C65/24, 65/40, 69/157, 69/94, 235/64, 255/24,
255/63, 317/40, C07D295/18, 215/08, 233/02,
213/30, 213/75, 211/16, 231/12, 239/47,

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07C65/24, 65/40, 69/157, 69/94, 235/64, 255/24,
255/63, 317/40, C07D295/18, 215/08, 233/02,
213/30, 213/75, 211/16, 231/12, 239/47,

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で利用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X A	MANDER L. N. and WOOLIAS M., 'Studies on Reductive Alkylation.', Aust. J. Chem., 1981, Vol. 34, p. 2249-2252 (化合物(4), (5))	1, 4, 5 2, 3, 6-14
A	JP 7-291859 A (エーザイ株式会社), 1995. 11. 07, 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	1-14
A	EP 955372 A2 (SUNTORY LIMITED), 1999. 11. 10, CLAIMS, Fig. 11 & JP 11-266872 A & US 6156516 A	1-14

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

12.06.02

国際調査報告の発送日

25.06.02

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

松本 直子



4H

9546

電話番号 03-3581-1101 内線 3443

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	WO 99/48491 A1 (サントリー株式会社), 1999. 09. 30, 特許請求の範囲 & EP. 1008346 A1	1-14
A	JP 4-226937 A (サントリー株式会社), 1992. 08. 17, 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	1-14
A	JP 62-286949 A (サントリー株式会社), 1987. 12. 12, 特許請求の範囲 (ファミリーなし)	1-14

A. 発明の属する分野の分類（国際特許分類（IPC））の続き

Int. Cl⁷ A61K31/192, 31/216, 31/235, 31/4406, 31/4409, 31/4453, 31/4545, 31/47, 31/4709,
31/5377, 31/603, 31/167, 31/609, 31/625, 31/277, 31/616, 31/5375, 31/44,
31/445, 31/415, 31/506,
A61P29/00, 31/12, 37/00, 43/00

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料（国際特許分類（IPC））の続き

Int. Cl⁷ A61K31/192, 31/216, 31/235, 31/4406, 31/4409, 31/4453, 31/4545, 31/47, 31/4709,
31/5377, 31/603, 31/167, 31/609, 31/625, 31/277, 31/616, 31/5375, 31/44,
31/445, 31/415, 31/506,
A61P29/00, 31/12, 37/00, 43/00